

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 特 許 公 報(B2)

(11) 特許番号

特許第4218984号
(P4218984)

(45) 発行日 平成21年2月4日(2009.2.4)

(24) 登録日 平成20年11月21日(2008.11.21)

(51) Int. Cl.	F I
CO7D 249/12 (2006.01)	CO7D 249/12 509
CO7D 401/06 (2006.01)	CO7D 401/06
CO7D 405/06 (2006.01)	CO7D 405/06
AO1N 43/653 (2006.01)	AO1N 43/653 N
AO1P 3/00 (2006.01)	AO1P 3/00

請求項の数 6 (全 88 頁)

(21) 出願番号	特願平9-541460	(73) 特許権者	バイエル・アクチエンゲゼルシヤフト
(86) (22) 出願日	平成9年5月9日(1997.5.9)		ドイツ連邦共和国デー51368レーフェルクーゼン
(65) 公表番号	特表2000-511891(P2000-511891A)	(74) 代理人	弁理士 特許業務法人小田島特許事務所
(43) 公表日	平成12年9月12日(2000.9.12)		
(86) 国際出願番号	PCT/EP1997/002373	(74) 代理人	弁理士 小田嶋 平吾
(87) 国際公開番号	W01997/044331	(72) 発明者	ヤウテラト, マンフレート
(87) 国際公開日	平成9年11月27日(1997.11.27)		ドイツ連邦共和国デー51399ブルシヤイト・ミュラーズハウム28
審査請求日	平成16年2月19日(2004.2.19)	(72) 発明者	ドウツツマン, シュテファン
(31) 優先権主張番号	19620407.0		ドイツ連邦共和国デー40764ランゲンフェルト・バイセンスタイン95
(32) 優先日	平成8年5月21日(1996.5.21)		
(33) 優先権主張国	ドイツ(DE)		

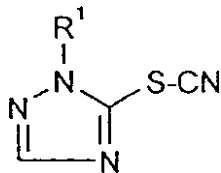
最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 チオシアナトートリアゾリル誘導体及びその殺微生物剤としての使用

(57) 【特許請求の範囲】

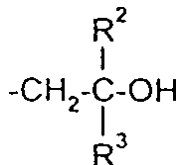
【請求項1】

式



(I)

式中、R¹は式



ここに

R²は炭素原子1～6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルを表し、ここにこれらの基はハロゲン、炭素原子1～4個を有するアルコキシ、アルコキシ部分に炭素原子1～4個を有するアルコキシイミノ及び炭素原子3～7個を有するシクロアルキルよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1～4置換されることができ、または炭素原子3～7個を有するシクロアルキルを表し、ここにこれらの基の各々はハロゲン、

シアノ及び炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルキルよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で 1 ~ 3 置換されることができ、または

アリール部分に炭素原子 6 ~ 10 個及び直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル部分に炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルキルを表し、ここにアリール部分は各々の場合にハロゲン、炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルキル、炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルコキシ、炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルキルチオ、炭素原子 1 または 2 個及び同一もしくは相異なるハロゲン原子 1 ~ 5 個を有するハロゲノアルキル、炭素原子 1 または 2 個及び同一もしくは相異なるハロゲン原子 1 ~ 5 個を有するハロゲノアルコキシ、炭素原子 1 または 2 個及び同一もしくは相異なるハロゲン原子 1 ~ 5 個を有するハロゲノアルキルチオ、炭素原子 3 ~ 7 個を有するシクロアルキル、フェニル、フェノキシ、アルコキシ部分に炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルコキシカルボニル、アルコキシ部分に炭素原子 1 ~ 4 個及びアルキル部分に炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルコキシイミノアルキル、ニトロ並びにシアノよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で 1 ~ 3 置換されることができ、または

アリール部分に炭素原子 6 ~ 10 個及び直鎖状もしくは分枝鎖状のオキシアルキル部分に炭素原子 1 ~ 4 個を有するアロキシアルキルを表し、ここにアリール部分は各々の場合にハロゲン、炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルキル、炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルコキシ、炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルキルチオ、炭素原子 1 または 2 個及び同一もしくは相異なるハロゲン原子 1 ~ 5 個を有するハロゲノアルキル、炭素原子 1 または 2 個及び同一もしくは相異なるハロゲン原子 1 ~ 5 個を有するハロゲノアルコキシ、炭素原子 1 または 2 個及び同一もしくは相異なるハロゲン原子 1 ~ 5 個を有するハロゲノアルキルチオ、炭素原子 3 ~ 7 個を有するシクロアルキル、フェニル、フェノキシ、アルコキシ部分に炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルコキシカルボニル、アルコキシ部分に炭素原子 1 ~ 4 個及びアルキル部分に炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルコキシイミノアルキル、ニトロ並びにシアノよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で 1 ~ 3 置換されることができ、または炭素原子 6 ~ 10 個を有するアリールを表し、ここにこれらの基の各々はハロゲン、炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルキル、炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルコキシ、炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルキルチオ、炭素原子 1 または 2 個及び同一もしくは相異なるハロゲン原子 1 ~ 5 個を有するハロゲノアルキル、炭素原子 1 または 2 個及び同一もしくは相異なるハロゲン原子 1 ~ 5 個を有するハロゲノアルコキシ、炭素原子 1 または 2 個及び同一もしくは相異なるハロゲン原子 1 ~ 5 個を有するハロゲノアルキルチオ、炭素原子 3 ~ 7 個を有するシクロアルキル、フェニル、フェノキシ、アルコキシ部分に炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルコキシカルボニル、アルコキシ部分に炭素原子 1 ~ 4 個及びアルキル部分に炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルコキシイミノアルキル、ニトロ並びにシアノよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で 1 ~ 3 置換されることができ、或いは

ヘテロ原子例えば窒素、硫黄及びまたは酸素 1 ~ 3 個を有する場合によってはベンゾ融合されていてよい 5 または 6 員のヘテロ芳香族基を表し、ここにこれらの基の各々はハロゲン、炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルキル、炭素原子 1 ~ 4 個を有するヒドロキシアルキル、炭素原子 3 ~ 8 個を有するヒドロキシアルキニル、炭素原子 1 または 2 個を有するアルコキシ、炭素原子 1 または 2 個を有するアルキルチオ、各々の場合に炭素原子 1 または 2 個及び同一もしくは相異なるハロゲン原子例えばフッ素または塩素原子 1 ~ 5 個を有するハロゲノアルキル、ハロゲノアルコキシ及びハロゲノアルキルチオ、ホルミル、各々のアルコキシ基中に炭素原子 1 または 2 個を有するジアルコキシメチル、炭素原子 2 ~ 4 個を有するアシル、アルコキシ部分に炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルコキシカルボニル、アルコキシ部分に炭素原子 1 ~ 4 個及びアルキル部分に炭素原子 1 ~ 3 個を有するアルコキシイミノアルキル、ニトロ並びにシアノよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で 1 ~ 3 置換されることができ、そして

R^3 は炭素原子 1 ~ 6 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルを表し、ここにこれらの基はハロゲン、炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルコキシ、アルコキシ部分に炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルコキシイミノ及び炭素原子 3 ~ 7 個を有するシクロアルキルよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で 1 ~ 4 置換されることができ、または

10

20

30

40

50

炭素原子 3 ~ 7 個を有するシクロアルキルを表し、ここにこれらの基の各々はハロゲン、シアノ及び炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルキルよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で 1 ~ 3 置換されることができ、または

アリール部分に炭素原子 6 ~ 10 個及び直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル部分に炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルキルを表し、ここにアリール部分は各々の場合にハロゲン、炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルキル、炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルコキシ、炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルキルチオ、炭素原子 1 または 2 個及び同一もしくは相異なるハロゲン原子 1 ~ 5 個を有するハロゲノアルキル、炭素原子 1 または 2 個及び同一もしくは相異なるハロゲン原子 1 ~ 5 個を有するハロゲノアルコキシ、炭素原子 1 または 2 個及び同一もしくは相異なるハロゲン原子 1 ~ 5 個を有するハロゲノアルキルチオ、炭素原子 3 ~ 7 個を有するシクロアルキル、フェニル、フェノキシ、アルコキシ部分に炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルコキシカルボニル、アルコキシ部分に炭素原子 1 ~ 4 個及びアルキル部分に炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルコキシイミノアルキル、ニトロ並びにシアノよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で 1 ~ 3 置換されることができ、または

アリール部分に炭素原子 6 ~ 10 個及び直鎖状もしくは分枝鎖状のオキシアルキル部分に炭素原子 1 ~ 4 個を有するアロキシアルキルを表し、ここにアリール部分は各々の場合にハロゲン、炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルキル、炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルコキシ、炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルキルチオ、炭素原子 1 または 2 個及び同一もしくは相異なるハロゲン原子 1 ~ 5 個を有するハロゲノアルキル、炭素原子 1 または 2 個及び同一もしくは相異なるハロゲン原子 1 ~ 5 個を有するハロゲノアルコキシ、炭素原子 1 または 2 個及び同一もしくは相異なるハロゲン原子 1 ~ 5 個を有するハロゲノアルキルチオ、炭素原子 3 ~ 7 個を有するシクロアルキル、フェニル、フェノキシ、アルコキシ部分に炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルコキシカルボニル、アルコキシ部分に炭素原子 1 ~ 4 個及びアルキル部分に炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルコキシイミノアルキル、ニトロ並びにシアノよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で 1 ~ 3 置換されることができ、または

炭素原子 6 ~ 10 個を有するアリールを表し、ここにこれらの基の各々はハロゲン、炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルキル、炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルコキシ、炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルキルチオ、炭素原子 1 または 2 個及び同一もしくは相異なるハロゲン原子 1 ~ 5 個を有するハロゲノアルキル、炭素原子 1 または 2 個及び同一もしくは相異なるハロゲン原子 1 ~ 5 個を有するハロゲノアルコキシ、炭素原子 1 または 2 個及び同一もしくは相異なるハロゲン原子 1 ~ 5 個を有するハロゲノアルキルチオ、炭素原子 3 ~ 7 個を有するシクロアルキル、フェニル、フェノキシ、アルコキシ部分に炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルコキシカルボニル、アルコキシ部分に炭素原子 1 ~ 4 個及びアルキル部分に炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルコキシイミノアルキル、ニトロ並びにシアノよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で 1 ~ 3 置換されることができ、或いは

ヘテロ原子例えば窒素、硫黄及び/または酸素 1 ~ 3 個を有する場合によってはベンゾ融合されていてよい 5 または 6 員のヘテロ芳香族基を表し、ここにこれらの基の各々はハロゲン、炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルキル、炭素原子 1 ~ 4 個を有するヒドロキシアルキル、炭素原子 3 ~ 8 個を有するヒドロキシアルキニル、炭素原子 1 または 2 個を有するアルコキシ、炭素原子 1 または 2 個を有するアルキルチオ、各々の場合に炭素原子 1 または 2 個及び同一もしくは相異なるハロゲン原子例えばフッ素または塩素原子 1 ~ 5 個を有するハロゲノアルキル、ハロゲノアルコキシ及びハロゲノアルキルチオ、ホルミル、各々のアルコキシ基中に炭素原子 1 または 2 個を有するジアルコキシメチル、炭素原子 2 ~ 4 個を有するアシル、アルコキシ部分に炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルコキシカルボニル、アルコキシ部分に炭素原子 1 ~ 4 個及びアルキル部分に炭素原子 1 ~ 3 個を有するアルコキシイミノアルキル、ニトロ並びにシアノよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で 1 ~ 3 置換されることができ

の基を表すか、または

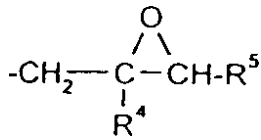
R¹は式

10

20

30

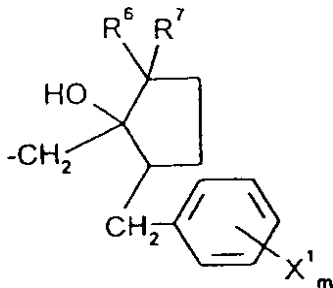
40



式中、 R^4 はメチル、エチル、 n -プロピル、イソプロピル、 n -ブチル、 s -ブチル、イソ-ブチル、 t -ブチル、フルオロ- t -ブチル、ジフルオロ- t -ブチル、場合によってはフッ素、塩素及び臭素よりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1~3置換されているもよい炭素原子3~6個を有するシクロアルキルを表すか、ナフチルを表すか、またはフッ素、塩素、臭素、ニトロ、フェニル、フェノキシ、メチル、エチル、 t -ブチル、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、ジフルオロメチル、ジフルオロクロロメチル、トリフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ及びトリフルオロメチルチオよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1~3置換されているもよいフェニルを表し、そして

R^5 はフッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、イソプロピル、 t -ブチル、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、ジフルオロメチル、ジフルオロクロロメチル、トリフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ及びトリフルオロメチルチオよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1~3置換され得るフェニルを表す、の基を表すか、または

R^1 は式



式中、 R^6 は水素、メチル、エチル、 n -プロピル、イソプロピル、 n -ブチル、イソブチル、 s -ブチル、 t -ブチルまたは n -ペンチルを表し、

R^7 は水素、メチル、エチル、 n -プロピル、イソプロピル、 n -ブチル、イソブチル、 s -ブチル、 t -ブチルまたは n -ペンチルを表し、

X^1 はフッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、 n -プロピル、イソプロピル、 n -ブチル、イソブチル、 s -ブチル、 t -ブチル、メトキシ、エトキシ、フェニル、フェノキシ、トリクロロメチル、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシまたはトリフルオロメチルチオを表し、

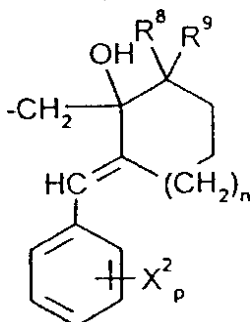
そして

m は0、1または2の数を表し、ここに

m

が2を表す場合、 X^1 は同一もしくは相異なる基を表し得る、の基を表すか、または

R^1 は式



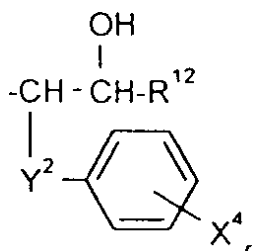
10

20

30

40

50



式中、 R^{12} は炭素原子1～4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、炭素原子1～4個及びフッ素原子1～5個を有するフルオロアルキル、場合によってはフッ素、塩素、臭素、メチル及びエチルよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1～3置換されていてもよい炭素原子3～6個を有するシクロアルキルを表すか、シクロアルキル部分に炭素原子3～6個及びアルキル部分に炭素原子1～3個を有するシクロアルキルアルキル、場合によってはフッ素、塩素及び臭素よりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1～3置換されていてもよいフェニルを表すか、或いは場合によってはフッ素、塩素及び臭素よりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1～3置換されていてもよいベンジルを表し、

X^4 はフッ素、塩素、臭素、ニトロ、メチル、エチル、*t*-ブチル、メトキシ、メチルチオ、トリクロロメチル、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメチルチオ、場合によってはフッ素、塩素、臭素及びメチルよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1または2置換されていてもよいフェニルを表すか、或いは場合によってはフッ素、塩素、臭素及びメチルよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1または2置換されていてもよいフェノキシを表し

r は0、1、2または3の数を表し、ここに

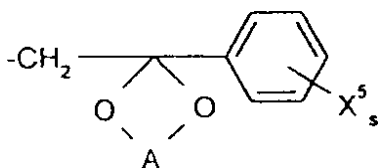
r

が2または3を表す場合、 X^4 は同一もしくは相異なる基を表し、そして

Y^2 は酸素原子を表すか、または CH_2 基を表す、

の基を表すか、または

R^1 は式



式中、 A は場合によってはフッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、*i*-ブチル、*s*-ブチル及び*t*-ブチルよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1～3置換されていてもよい炭素原子2または3個を有するアルカンジイルを表し、

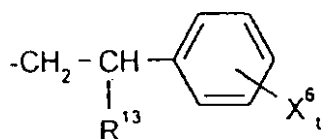
X^5 はフッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、メトキシ、メチルチオ、トリクロロメチル、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチルチオ、ジフルオロメトキシ、場合によってはフッ素、塩素及びメチルよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1～3置換されていてもよいフェニルを表し、または場合によってはフッ素、塩素及びメチルよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1～3置換されていてもよいフェノキシを表し、

s は0、1、2または3の数を表し、ここに

s

が2または3を表す場合、 X^5 は同一もしくは相異なる基を表す、の基を表すか、または

R^1 は式



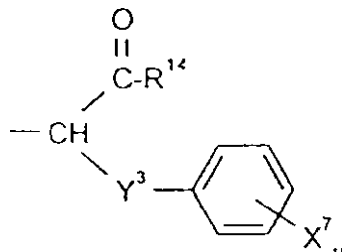
式中、 R^{13} は炭素原子1～6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、炭素原子1～6個及びフッ素、塩素及び/または臭素原子1～5個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲノアルキル、炭素原子1～3個並びにフルオロアルコキシ部分にフッ素原子1～5個及びアルキル部分に炭素原子1～3個を有するフルオロアルコキシアリル、場合によってはフッ素、塩素、臭素、メチル及びエチルよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1～3置換されているもよい炭素原子3～6個を有するシクロアルキル、シクロアルキル部分に炭素原子3～6個及びアルキル部分に炭素原子1～3個を有するシクロアルキルアルキル、場合によってはフッ素、塩素及び臭素よりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1～3置換されているもよいフェニルを表すか、或いは場合によってはフッ素、塩素及び臭素よりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1～3置換されているもよいアルキル部分に炭素原子1または2個を有するフェニルアルキルを表し、 X^6 はフッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、*t*-ブチル、メトキシ、メチルチオ、トリクロロメチル、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメチルチオ、場合によってはフッ素、塩素、臭素及びメチルよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1または2置換されているもよいフェニルを表すか、或いは場合によってはフッ素、塩素、臭素及びメチルよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1または2置換されているもよいフェノキシを表し、そして

t は0、1、2または3の数を表し、ここに

t

が2または3を表す場合、 X^6 は同一もしくは相異なる基を表す、の基を表すか、または

R^1 は式



式中、 R^{14} は炭素原子1～4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、炭素原子1～4個及びフッ素原子1～5個を有するフルオロアルキル、場合によってはフッ素、塩素、臭素、メチル及びエチルよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1～3置換されているもよい炭素原子3～6個を有するシクロアルキル、シクロアルキル部分に炭素原子3～6個及びアルキル部分に炭素原子1～3個を有するシクロアルキルアルキル、場合によってはフッ素、塩素及び臭素よりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1～3置換されているもよいフェニルを表すか、或いは場合によってはフッ素、塩素及び臭素よりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1～3置換されているもよいベンジルを表し、

X^7 はフッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、*t*-ブチル、メトキシ、メチルチオ、トリクロロメチル、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメチルチオ、場合によってはフッ素、塩素、臭素及びメチルよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1または2置換されているもよいフェニルを表すか、或いは場合によってはフッ素、塩素、臭素及びメチルよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1または2置換されているもよいフェノキシを表し、

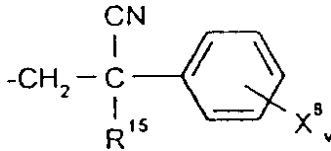
u は0、1、2または3の数を表し、ここに

u

が2または3を表す場合、 X^7 は同一もしくは相異なる基を表し、そして

Y^3 は酸素原子を表すか、または CH_2 基を表す、
の基を表すか、または

R^{15} は式



式中、 R^{15} は炭素原子1～4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、炭素原子1～4個及びハロゲン原子1～5個を有するハロゲノアルキル、場合によってはハロゲン、炭素原子1～4個を有するアルキル、炭素原子1または2個及びハロゲン原子1～5個を有するハロゲノアルキル、炭素原子1～4個を有するアルコキシ並びに炭素原子1または2個及びハロゲン原子1～5個を有するハロゲノアルコキシよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1～3置換されているもよいフェニルを表すか、或いは、場合によってはハロゲン、炭素原子1～4個を有するアルキル、炭素原子1または2個及びハロゲン原子1～5個を有するハロゲノアルキル、炭素原子1～4個を有するアルコキシ並びに炭素原子1または2個及びハロゲン原子1～5個を有するハロゲノアルコキシよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1～3置換されているもよいアルキル部分に炭素原子1～4個を有するフェニルアルキルを表し、

X^8 はフッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、*t*-ブチル、メトキシ、メチルチオ、トリクロロメチル、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメチルチオ、場合によってはフッ素、塩素、臭素及びメチルよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1または2置換されているもよいフェニルを表すか、或いは場合によってはフッ素、塩素、臭素及びメチルよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1または2置換されているもよいフェノキシを表し、そして

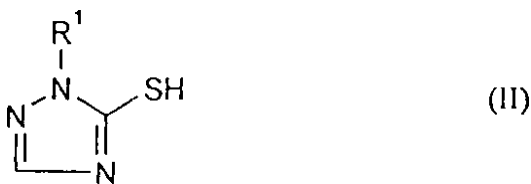
v は0、1、2または3の数を表し、ここに

v

が2または3を表す場合、 X^8 は同一もしくは相異なる基を表す、の基を表す、
のチオシアナト-トリアゾリル誘導体もしくはその酸付加塩または金属塩錯体。

【請求項2】

式



式中、 R^1 は上記のものである、
のメルカプト-トリアゾールを
希釈剤の存在下で式

$Cl-CN$ (III)

のクロロシアンと反応させることを特徴とする、請求の範囲第1項記載の式(I)のチオシアナト-トリアゾリル誘導体の製造方法。

【請求項3】

請求の範囲第1項記載の式(I)のチオシアナト-トリアゾリル誘導体を少なくとも1種と増量剤及び/または表面活性剤を含むことを特徴とする、殺微生物組成物。

【請求項4】

作物保護及び材料の保護における殺微生物剤としての、請求の範囲第1項記載の式(I)のチオシアナト-トリアゾリル誘導体の使用。

【請求項5】

請求の範囲第1項記載の式(I)のチオシアナト-トリアゾリル誘導体を微生物及び/またはその生育地に施用することを特徴とする、作物保護及び材料の保護における望ましく

10

20

30

40

50

ない微生物の抑制方法。

【請求項 6】

請求の範囲第 1 項記載の式 (I) のチオシアナト - トリアゾリル誘導体を増量剤及び / または表面活性剤と混合することを特徴とする、殺微生物組成物の製造方法。

【発明の詳細な説明】

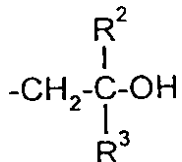
本発明は新規なチオシアナト - トリアゾリル誘導体、その製造方法及びその殺微生物剤 (microbicide) としての使用に関する。

多数のトリアゾリル誘導体が殺菌・殺カビ (fungicidal) 特性を有することは既知である (ヨーロッパ特許出願公開第 0, 0 1 5, 7 5 6 号、同第 0, 0 4 0, 3 4 5 号、同第 0, 0 5 2, 4 2 4 号、同第 0, 0 6 1, 8 3 5 号、同第 0, 2 9 7, 3 4 5 号、同第 0, 0 9 4, 5 6 4 号、同第 0, 1 9 6, 0 3 8 号、同第 0, 2 6 7, 7 7 8 号、同第 0, 3 7 8, 9 5 3 号、同第 0, 0 4 4, 6 0 5 号、同第 0, 0 6 9, 4 4 2 号、同第 0, 0 5 5, 8 3 3 号、同第 0, 3 0 1, 3 9 3 号、ドイツ国特許出願公開第 2, 3 2 4, 0 1 0 号、同第 2, 7 3 7, 4 8 9 号、同第 2, 5 5 1, 5 6 0 号、ヨーロッパ特許出願公開第 0, 0 6 5, 4 8 5 号、ドイツ国特許出願公開第 2, 7 3 5, 8 7 2 号、ヨーロッパ特許出願公開第 0, 2 3 4, 2 4 2 号、ドイツ国特許出願公開第 2, 2 0 1, 0 6 3 号、ヨーロッパ特許出願公開第 0, 1 4 5, 2 9 4 号及びドイツ国特許出願公開第 3, 7 2 1, 7 8 6 号参照)。これらの化合物の活性は良好であるが、低い施用割合では幾つかの場合に満足できるものではない。

従って、本発明は式



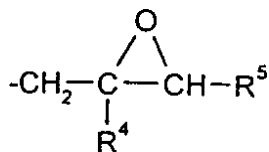
式中、R¹は式



の基を表し、ここに

R²及びR³は同一もしくは相異なり、かつ各々場合によっては置換されていてもよいアルキル、場合によっては置換されていてもよいアルケニル、場合によっては置換されていてもよいシクロアルキル、場合によっては置換されていてもよいアラルキル、場合によっては置換されていてもよいアラルケニル、場合によっては置換されていてもよいアロキシ (aroxy) アルキル、場合によっては置換されていてもよいアリールまたは場合によっては置換されていてもよいヘテロアリールを表すか、或いは

R¹は式



の基を表し、ここに

R⁴は炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルキル、炭素原子 1 ~ 4 個及びハロゲン原子 1 ~ 5 個を有するハロゲノアルキル、炭素原子 3 ~ 7 個を有する場合によってはハロゲン置換されていてもよいシクロアルキル、ナフチル、または場合によってはハロゲン、ニトロ、フェニル、フェノキシ、炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルキル、炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルコキシ、炭素原子 1 ~ 4 個及びハロゲン原子 1 ~ 5 個を有するハロゲノアルキル、炭素原子 1 ~ 4 個及びハロゲン原子 1 ~ 5 個を有するハロゲノアルコキシ並びに炭素原子 1 ~ 4

10

20

30

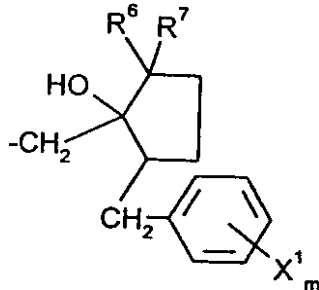
40

50

個及びハロゲン原子 1 ~ 5 個を有するハロゲノアルキルチオよりなる群から選ばれる同一もしくは相異なる置換基で 1 ~ 3 置換されていてもよいフェニルを表し、そして

R⁵は場合によってはハロゲン、炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルキル、炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルコキシ、炭素原子 1 ~ 4 個及びハロゲン原子 1 ~ 5 個を有するハロゲノアルキル、炭素原子 1 ~ 4 個及びハロゲン原子 1 ~ 5 個を有するハロゲノアルコキシ並びに炭素原子 1 ~ 4 個及びハロゲン原子 1 ~ 5 個を有するハロゲノアルキルチオよりなる群から選ばれる同一もしくは相異なる置換基で 1 ~ 3 置換されていてもよいフェニルを表すか、或いは

R¹は式



10

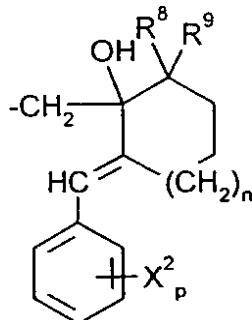
の基を表し、ここに

R⁶及びR⁷は相互に独立して各々水素または炭素原子 1 ~ 6 個を有するアルキルを表し、X¹はハロゲン、炭素原子 1 ~ 5 個を有するアルキル、炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルコキシ、フェニル、フェノキシ、炭素原子 1 ~ 4 個及びハロゲン原子 1 ~ 5 個を有するハロゲノアルキル、炭素原子 1 ~ 4 個及びハロゲン原子 1 ~ 5 個を有するハロゲノアルコキシを表すか、または炭素原子 1 ~ 4 個及びハロゲン原子 1 ~ 5 個を有するハロゲノアルキルチオを表し、そして

20

mは 0、1 または 2 の数を表すか、或いは

R¹は式



30

の基を表し、ここに

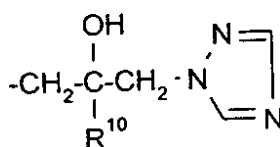
R⁸及びR⁹は相互に独立して各々水素または炭素原子 1 ~ 6 個を有するアルキルを表し、X²はハロゲン、シアノ、ニトロ、炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルキル、炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルコキシ、炭素原子 1 ~ 4 個及びハロゲン原子 1 ~ 5 個を有するハロゲノアルキル、炭素原子 1 ~ 4 個及びハロゲン原子 1 ~ 5 個を有するハロゲノアルコキシまたはフェニルを表し、

40

nは 0 または 1 の数を表し、そして

pは 0、1 または 2 の数を表すか、

R¹は式

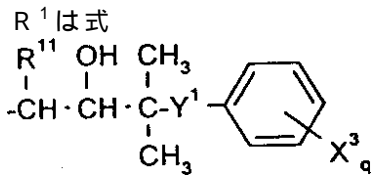


の基を表し、ここに

R¹⁰は炭素原子 1 ~ 6 個を有するアルキル、炭素原子 1 ~ 6 個及びハロゲン原子 1 ~ 5 個

50

を有するハロゲノアルキル、場合によってはハロゲン及び/または炭素原子1～4個を有するアルキルで置換されていてもよく炭素原子3～6個を有するシクロアルキル、場合によっては置換されていてもよいアリールを表すか、或いは場合によっては置換されていてもよいアラルキルを表すか、或いは



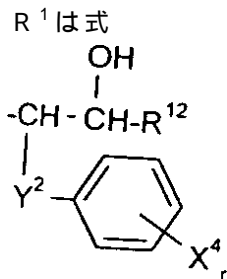
の基を表し、ここに

R¹¹は水素、アルキルまたは場合によっては置換されていてもよいシクロアルキルを表し、

X³はハロゲン、炭素原子1～4個を有するアルキル、炭素原子1～4個を有するアルコキシ、炭素原子1～4個を有するアルキルチオ、炭素原子1～4個及びハロゲン原子1～5個を有するハロゲノアルキル、炭素原子1～4個及びハロゲン原子1～5個を有するハロゲノアルコキシ、炭素原子1～4個及びハロゲン原子1～5個を有するハロゲノアルキルチオ、場合によってはハロゲン及び/または炭素原子1～4個を有するアルキルで置換されていてもよいフェニルを表すか、または場合によってはハロゲン及び/または炭素原子1～4個を有するアルキルで置換されていてもよいフェノキシを表し、

qは0、1、2または3の数を表し、そして

Y¹は酸素原子、CH₂基または直接結合を表すか、或いは



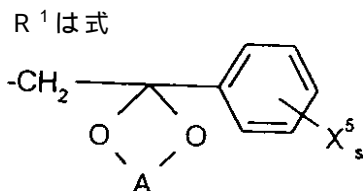
の基を表し、ここに

R¹²は炭素原子1～6個を有するアルキル、炭素原子1～4個及びハロゲン原子1～5個を有するハロゲノアルキル、場合によってはハロゲン及び/または炭素原子1～4個を有するアルキルで置換されていてもよく炭素原子3～7個を有するシクロアルキル、シクロアルキル部分に炭素原子3～7個及びアルキル部分に炭素原子1～4個を有するシクロアルキルアルキル、場合によってはハロゲン置換されていてもよいフェニルを表すか、または場合によってはハロゲン置換されていてもよいベンジルを表し、

X⁴はハロゲン、ニトロ、炭素原子1～4個を有するアルキル、炭素原子1～4個を有するアルコキシ、炭素原子1～4個を有するアルキルチオ、炭素原子1～4個及びハロゲン原子1～5個を有するハロゲノアルキル、炭素原子1～4個及びハロゲン原子1～5個を有するハロゲノアルコキシ、炭素原子1～4個及びハロゲン原子1～5個を有するハロゲノアルキルチオ、場合によってはハロゲン及び/または炭素原子1～4個を有するアルキルで置換されていてもよいフェニルを表すか、または場合によってはハロゲン及び/または炭素原子1～4個を有するアルキルで置換されていてもよいフェノキシを表し、

rは0、1、2または3の数を表し、そして

Y²は酸素原子を表すか、またはCH₂基を表すか、或いは



10

20

30

40

50

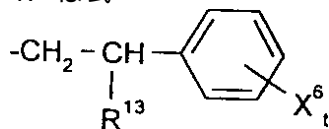
の基を表し、ここに

Aは場合によってはハロゲン及び/または炭素原子1～4個を有するアルキルで置換されていてもよい炭素原子2～3個を有するアルカンジイルを表し、

X⁵はハロゲン、炭素原子1～4個を有するアルキル、炭素原子1～4個を有するアルコキシ、炭素原子1～4個を有するアルキルチオ、炭素原子1～4個及びハロゲン原子1～5個を有するハロゲノアルキル、炭素原子1～4個及びハロゲン原子1～5個を有するハロゲノアルコキシ、炭素原子1～4個及びハロゲン原子1～5個を有するハロゲノアルキルチオ、場合によってはハロゲン及び/または炭素原子1～4個を有するアルキルで置換されていてもよいフェニルを表すか、または場合によってはハロゲン及び/または炭素原子1～4個を有するアルキルで置換されていてもよいフェノキシを表し、そして

sは0、1、2または3の数を表すか、或いは

R¹は式



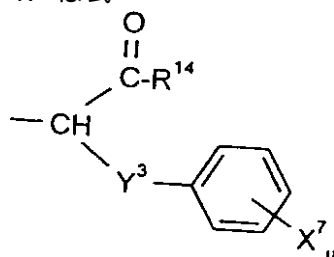
の基を表し、ここに

R¹³は炭素原子1～10個を有するアルキル、炭素原子1～6個及びハロゲン原子1～5個を有するハロゲノアルキル、フルオロアルコキシ部分に炭素原子1～4個及びアルキル部分に炭素原子1～4個を有するフルオロアルコキシアルキル、場合によってはハロゲン及び/または炭素原子1～4個を有するアルキルで置換されていてもよく炭素原子3～7個を有するシクロアルキル、シクロアルキル部分に炭素原子3～7個及びアルキル部分に炭素原子1～4個を有するシクロアルキルアルキル、場合によってはハロゲン置換されていてもよいフェニルを表すか、または場合によってはハロゲン置換されていてもよくアルキル部分に炭素原子1～4個を有するフェニルアルキルを表し、

X⁶はハロゲン、炭素原子1～4個を有するアルキル、炭素原子1～4個を有するアルコキシ、炭素原子1～4個を有するアルキルチオ、炭素原子1～4個及びハロゲン原子1～5個を有するハロゲノアルキル、炭素原子1～4個及びハロゲン原子1～5個を有するハロゲノアルコキシ、炭素原子1～4個及びハロゲン原子1～5個を有するハロゲノアルキルチオ、場合によってはハロゲン及び/または炭素原子1～4個を有するアルキルで置換されていてもよいフェニルを表すか、または場合によってはハロゲン及び/または炭素原子1～4個を有するアルキルで置換されていてもよいフェノキシを表し、そして

tは0、1、2または3の数を表すか、或いは

R¹は式



の基を表し、ここに

R¹⁴は炭素原子1～6個を有するアルキル、炭素原子1～4個及びハロゲン原子1～5個を有するハロゲノアルキル、場合によってはハロゲン及び/または炭素原子1～4個を有するアルキルで置換されていてもよく炭素原子3～7個を有するシクロアルキル、シクロアルキル部分に炭素原子3～7個及びアルキル部分に炭素原子1～4個を有するシクロアルキルアルキル、場合によってはハロゲン置換されていてもよいフェニルを表すか、または場合によってはハロゲン置換されていてもよいベンジルを表し、

X⁷はハロゲン、炭素原子1～4個を有するアルキル、炭素原子1～4個を有するアルコキシ、炭素原子1～4個を有するアルキルチオ、炭素原子1～4個及びハロゲン原子1～

10

20

30

40

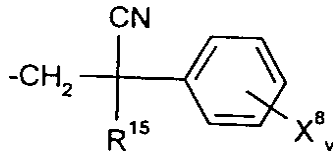
50

5 個を有するハロゲノアルキル、炭素原子 1 ~ 4 個及びハロゲン原子 1 ~ 5 個を有するハロゲノアルコキシ、炭素原子 1 ~ 4 個及びハロゲン原子 1 ~ 5 個を有するハロゲノアルキルチオ、場合によってはハロゲン及び/または炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルキルで置換されているもよいフェニルを表すか、または場合によってはハロゲン及び/または炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルキルで置換されているもよいフェノキシを表し、

u は 0、1、2 または 3 の数を表し、そして

Y³ は酸素原子を表すか、または C H₂ 基を表すか、或いは

R¹ は式



10

の基を表し、ここに

R¹⁵ は炭素原子 1 ~ 6 個を有するアルキル、炭素原子 1 ~ 6 個及びハロゲン原子 1 ~ 5 個を有するハロゲノアルキル、場合によっては置換されているもよいアリアルキルを表すか、または場合によっては置換されているもよいアラールキルを表し、

X⁸ はハロゲン、炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルキル、炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルコキシ、炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルキルチオ、炭素原子 1 ~ 4 個及びハロゲン原子 1 ~ 5 個を有するハロゲノアルキル、炭素原子 1 ~ 4 個及びハロゲン原子 1 ~ 5 個を有するハロゲノアルコキシ、炭素原子 1 ~ 4 個及びハロゲン原子 1 ~ 5 個を有するハロゲノアルキルチオ、場合によってはハロゲン及び/または炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルキルで置換されているもよいフェニルを表すか、または場合によってはハロゲン及び/または炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルキルで置換されているもよいフェノキシを表し、そして

20

v は 0、1、2 または 3 の数を表す、

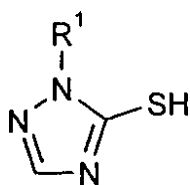
の新規なチオシアナト - トリアゾリル誘導体並びにその酸付加塩及び金属塩錯体を提供する。

本発明による多数の物質は 1 個またはそれ以上の不斉置換された炭素原子を有する。これらのものは従って光学異性体の状態で得ることができる。本発明は個々の異性体及びその混合物の両方に関する。

更に式 (I) のチオシアナト - トリアゾリル誘導体並びにその酸付加塩及び金属塩錯体は

30

式



(II)

式中、R¹ は上記のものである、

のメルカプト - トリアゾールを希釈剤の存在下で式



のクロロシアンと反応させ、そして適当ならば酸または金属塩を生じる式 (I) の化合物に続いて添加する場合に得られることが見いだされた。

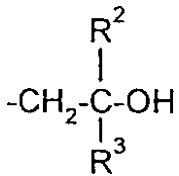
40

最終的に、式 (I) の新規なチオシアナト - トリアゾリル誘導体並びにその酸付加塩及び金属塩錯体は極めて良好な殺微生物 (microbicidal) 特性を有し、そして望ましくない微生物を抑制するための作物保護及び材料の保護の両方において使用し得る。

驚くべきことに、本発明による物質は構造的に最も類似した同じ作用指向の化合物より良好な殺微生物活性、殊に殺菌・殺カビ活性を有する。

式 (I) は本発明によるチオシアナト - トリアゾリル誘導体の一般的定義を与える。

R¹ は好ましくは式



式中、 R^2 は好ましくは炭素原子1～6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルを表し、ここにこれらの基はハロゲン、炭素原子1～4個を有するアルコキシ、アルコキシ部分に炭素原子1～4個を有するアルコキシミノ及び炭素原子3～7個を有するシクロアルキルよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1～4置換されることができ

10

か、炭素原子2～6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルケニルを表し、ここにこれらの基の各々はハロゲン、炭素原子1～4個を有するアルコキシ、及び炭素原子3～7個を有するシクロアルキルよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1～3置換されることができ

か、炭素原子3～7個を有するシクロアルキルを表し、ここにこれらの基の各々はハロゲン、シアノ及び炭素原子1～4個を有するアルキルよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1～3置換されることができ

か、アリール部分に炭素原子6～10個及び直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル部分に炭素原子1～4個を有するアルキルを表し、ここにアリール部分は各々の場合にハロゲン、炭素原子1～4個を有するアルキル、炭素原子1～4個を有するアルコキシ、炭素原子1～4個を有するアルキルチオ、炭素原子1または2個及び同一もしくは相異なるハロゲン原子1～5個を有するハロゲノアルキル、炭素原子1または2個及び同一もしくは相異なるハロゲン原子1～5個を有するハロゲノアルコキシ、炭素原子1または2個及び同一もしくは相異なるハロゲン原子1～5個を有するハロゲノアルキルチオ、炭素原子3～7個を有するシクロアルキル、フェニル、フェノキシ、アルコキシ部分に炭素原子1～4個を有するアルコキシカルボニル、アルコキシ部分に炭素原子1～4個及びアルキル部分に炭素原子1～4個を有するアルコキシミノアルキル、ニトロ並びにシアノよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1～3置換されることができ

20

か、アリール部分に炭素原子6～10個及びアルケニル部分に炭素原子2～4個を有するアルケニルを表し、ここにアリール部分は各々の場合にハロゲン、炭素原子1～4個を有するアルキル、炭素原子1～4個を有するアルコキシ、炭素原子1～4個を有するアルキルチオ、炭素原子1または2個及び同一もしくは相異なるハロゲン原子1～5個を有するハロゲノアルキル、炭素原子1または2個及び同一もしくは相異なるハロゲン原子1～5個を有するハロゲノアルコキシ、炭素原子1または2個及び同一もしくは相異なるハロゲン原子1～5個を有するハロゲノアルキルチオ、炭素原子3～7個を有するシクロアルキル、フェニル、フェノキシ、アルコキシ部分に炭素原子1～4個を有するアルコキシカルボニル、アルコキシ部分に炭素原子1～4個及びアルキル部分に炭素原子1～4個を有するアルコキシミノアルキル、ニトロ並びにシアノよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1～3置換されることができ

30

か、アリール部分に炭素原子6～10個及び直鎖状もしくは分枝鎖状のオキシアルキル部分に炭素原子1～4個を有するアロキシアルキルを表し、ここにアリール部分は各々の場合にハロゲン、炭素原子1～4個を有するアルキル、炭素原子1～4個を有するアルコキシ、炭素原子1～4個を有するアルキルチオ、炭素原子1または2個及び同一もしくは相異なるハロゲン原子1～5個を有するハロゲノアルキル、炭素原子1または2個及び同一もしくは相異なるハロゲン原子1～5個を有するハロゲノアルコキシ、炭素原子1または2個及び同一もしくは相異なるハロゲン原子1～5個を有するハロゲノアルキルチオ、炭素原子3～7個を有するシクロアルキル、フェニル、フェノキシ、アルコキシ部分に炭素原子1～4個を有するアルコキシカルボニル、アルコキシ部分に炭素原子1～4個及びアルキル部分に炭素原子1～4個を有するアルコキシミノアルキル、ニトロ並びにシアノよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1～3置換されることができ

40

50

炭素原子 6 ~ 10 個を有するアリールを表し、ここにこれらの基の各々はハロゲン、炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルキル、炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルコキシ、炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルキルチオ、炭素原子 1 または 2 個及び同一もしくは相異なるハロゲン原子 1 ~ 5 個を有するハロゲノアルキル、炭素原子 1 または 2 個及び同一もしくは相異なるハロゲン原子 1 ~ 5 個を有するハロゲノアルコキシ、炭素原子 1 または 2 個及び同一もしくは相異なるハロゲン原子 1 ~ 5 個を有するハロゲノアルキルチオ、炭素原子 3 ~ 7 個を有するシクロアルキル、フェニル、フェノキシ、アルコキシ部分に炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルコキシカルボニル、アルコキシ部分に炭素原子 1 ~ 4 個及びアルキル部分に炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルコキシイミノアルキル、ニトロ並びにシアノよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で 1 ~ 3 置換されることができ、或いは

ヘテロ原子例えば窒素、硫黄及び酸素 1 ~ 3 個を有する場合によってはベンゾ融合されていてもよい 5 または 6 員のヘテロ芳香族基を表し、ここにこれらの基の各々はハロゲン、炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルキル、炭素原子 1 ~ 4 個を有するヒドロキシアルキル、炭素原子 3 ~ 8 個を有するヒドロキシアルキニル、炭素原子 1 または 2 個を有するアルコキシ、炭素原子 1 または 2 個を有するアルキルチオ、各々の場合に炭素原子 1 または 2 個及び同一もしくは相異なるハロゲン原子例えばフッ素または塩素原子 1 ~ 5 個を有するハロゲノアルキル、ハロゲノアルコキシ及びハロゲノアルキルチオ、ホルミル、各々のアルコキシ基中に炭素原子 1 または 2 個を有するジアルコキシメチル、炭素原子 2 ~ 4 個を有するアシル、アルコキシ部分に炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルコキシカルボニル、アルコキシ部分に炭素原子 1 ~ 4 個及びアルキル部分に炭素原子 1 ~ 3 個を有するアルコキシイミノアルキル、ニトロ並びにシアノよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で 1 ~ 3 置換されることができ、そして

R^3 は好ましくは炭素原子 1 ~ 6 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルを表し、ここにこれらの基はハロゲン、炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルコキシ、アルコキシ部分に炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルコキシイミノ及び炭素原子 3 ~ 7 個を有するシクロアルキルよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で 1 ~ 4 置換されることができ、炭素原子 2 ~ 6 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルケニルを表し、ここにこれらの基の各々はハロゲン、炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルコキシ、及び炭素原子 3 ~ 7 個を有するシクロアルキルよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で 1 ~ 3 置換されることができ、

炭素原子 3 ~ 7 個を有するシクロアルキルを表し、ここにこれらの基の各々はハロゲン、シアノ及び炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルキルよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で 1 ~ 3 置換されることができ、

アリール部分に炭素原子 6 ~ 10 個及び直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル部分に炭素原子 1 ~ 4 個を有するアラルキルを表し、ここにアリール部分は各々の場合にハロゲン、炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルキル、炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルコキシ、炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルキルチオ、炭素原子 1 または 2 個及び同一もしくは相異なるハロゲン原子 1 ~ 5 個を有するハロゲノアルキル、炭素原子 1 または 2 個及び同一もしくは相異なるハロゲン原子 1 ~ 5 個を有するハロゲノアルコキシ、炭素原子 1 または 2 個及び同一もしくは相異なるハロゲン原子 1 ~ 5 個を有するハロゲノアルキルチオ、炭素原子 3 ~ 7 個を有するシクロアルキル、フェニル、フェノキシ、アルコキシ部分に炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルコキシカルボニル、アルコキシ部分に炭素原子 1 ~ 4 個及びアルキル部分に炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルコキシイミノアルキル、ニトロ並びにシアノよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で 1 ~ 3 置換されることができ、

アリール部分に炭素原子 6 ~ 10 個及びアルケニル部分に炭素原子 2 ~ 4 個を有するアラルケニルを表し、ここにアリール部分は各々の場合にハロゲン、炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルキル、炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルコキシ、炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルキルチオ、炭素原子 1 または 2 個及び同一もしくは相異なるハロゲン原子 1 ~ 5 個を有するハロゲノアルキル、炭素原子 1 または 2 個及び同一もしくは相異なるハロゲン原子 1 ~ 5 個を有するハロゲノアルコキシ、炭素原子 1 または 2 個及び同一もしくは相異なるハロゲン

10

20

30

40

50

原子 1 ~ 5 個を有するハロゲンアルキルチオ、炭素原子 3 ~ 7 個を有するシクロアルキル、フェニル、フェノキシ、アルコキシ部分に炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルコキシカルボニル、アルコキシ部分に炭素原子 1 ~ 4 個及びアルキル部分に炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルコキシイミノアルキル、ニトロ並びにシアノよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で 1 ~ 3 置換されることができ、

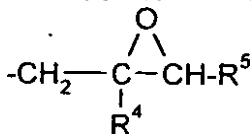
アリール部分に炭素原子 6 ~ 10 個及び直鎖状もしくは分枝鎖状のオキシアルキル部分に炭素原子 1 ~ 4 個を有するアロキシアリールを表し、ここにアリール部分は各々の場合にハロゲン、炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルキル、炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルコキシ、炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルキルチオ、炭素原子 1 または 2 個及び同一もしくは相異なるハロゲン原子 1 ~ 5 個を有するハロゲンアルキル、炭素原子 1 または 2 個及び同一もしくは相異なるハロゲン原子 1 ~ 5 個を有するハロゲンアルコキシ、炭素原子 1 または 2 個及び同一もしくは相異なるハロゲン原子 1 ~ 5 個を有するハロゲンアルキルチオ、炭素原子 3 ~ 7 個を有するシクロアルキル、フェニル、フェノキシ、アルコキシ部分に炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルコキシカルボニル、アルコキシ部分に炭素原子 1 ~ 4 個及びアルキル部分に炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルコキシイミノアルキル、ニトロ並びにシアノよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で 1 ~ 3 置換されることができ、

炭素原子 6 ~ 10 個を有するアリールを表し、ここにこれらの基の各々はハロゲン、炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルキル、炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルコキシ、炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルキルチオ、炭素原子 1 または 2 個及び同一もしくは相異なるハロゲン原子 1 ~ 5 個を有するハロゲンアルキル、炭素原子 1 または 2 個及び同一もしくは相異なるハロゲン原子 1 ~ 5 個を有するハロゲンアルコキシ、炭素原子 1 または 2 個及び同一もしくは相異なるハロゲン原子 1 ~ 5 個を有するハロゲンアルキルチオ、炭素原子 3 ~ 7 個を有するシクロアルキル、フェニル、フェノキシ、アルコキシ部分に炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルコキシカルボニル、アルコキシ部分に炭素原子 1 ~ 4 個及びアルキル部分に炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルコキシイミノアルキル、ニトロ並びにシアノよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で 1 ~ 3 置換されることができ、或いは

ヘテロ原子例えば窒素、硫黄及び酸素 1 ~ 3 個を有する場合によってはベンゾ融合されていてもよい 5 または 6 員のヘテロ芳香族基を表し、ここにこれらの基の各々はハロゲン、炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルキル、炭素原子 1 ~ 4 個を有するヒドロキシアリール、炭素原子 3 ~ 8 個を有するヒドロキシアリール、炭素原子 1 または 2 個を有するアルコキシ、炭素原子 1 または 2 個を有するアルキルチオ、各々の場合に炭素原子 1 または 2 個及び同一もしくは相異なるハロゲン原子例えばフッ素または塩素原子 1 ~ 5 個を有するハロゲンアルキル、ハロゲンアルコキシ及びハロゲンアルキルチオ、ホルミル、各々のアルコキシ基中に炭素原子 1 または 2 個を有するジアルコキシメチル、炭素原子 2 ~ 4 個を有するアシル、アルコキシ部分に炭素原子 1 ~ 4 個を有するアルコキシカルボニル、アルコキシ部分に炭素原子 1 ~ 4 個及びアルキル部分に炭素原子 1 ~ 3 個を有するアルコキシイミノアルキル、ニトロ並びにシアノよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で 1 ~ 3 置換されることができ、

の基を表す。

R¹ は更に好ましくは式



式中、R⁴ は好ましくはメチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、s-ブチル、イソ-ブチル、t-ブチル、フルオロ-t-ブチル、ジフルオロ-t-ブチル、場合によってはフッ素、塩素及び臭素よりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で 1 ~ 3 置換されていてもよい炭素原子 3 ~ 6 個を有するシクロアルキルを表すか、ナフチルを表すか、またはフッ素、塩素、臭素、ニトロ、フェニル、フェノキシ、メチル、エチル、t-ブチル、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、ジフル

10

20

30

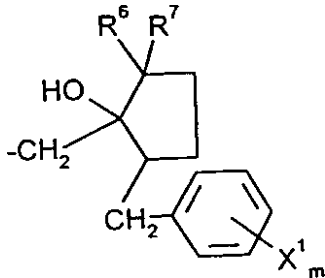
40

50

オロメチル、ジフルオロクロロメチル、トリフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ及びトリフルオロメチルチオよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1～3置換されていてもよいフェニルを表し、そして

R^5 は好ましくはフッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、イソプロピル、*t*-ブチル、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、ジフルオロメチル、ジフルオロクロロメチル、トリフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ及びトリフルオロメチルチオよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1～3置換され得るフェニルを表す、
の基を表す。

R^1 は更に好ましくは式



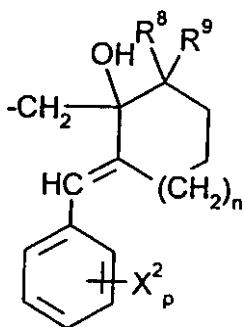
式中、 R^6 は好ましくは水素、メチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、イソブチル、*s*-ブチル、*t*-ブチルまたは*n*-ペンチルを表し、

R^7 は好ましくは水素、メチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、イソブチル、*s*-ブチル、*t*-ブチルまたは*n*-ペンチルを表し、

X^1 は好ましくはフッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、イソブチル、*s*-ブチル、*t*-ブチル、メトキシ、エトキシ、フェニル、フェノキシ、トリクロロメチル、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシまたはトリフルオロメチルチオを表し、そして

m はまた好ましくは0、1または2の数を表し、ここに
 m が2を表す場合、 X^1 は同一もしくは相異なる基を表し得る、
の基を表す。

R^1 は更に好ましくは式



式中、 R^8 は好ましくは水素、メチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、イソブチル、*s*-ブチル、*t*-ブチルまたは*n*-ペンチルを表し、

R^9 は好ましくは水素、メチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、イソブチル、*s*-ブチル、*t*-ブチルまたは*n*-ペンチルを表し、

X^2 は好ましくはフッ素、塩素、臭素、シアノ、ニトロ、メチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、イソブチル、*s*-ブチル、*t*-ブチル、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、ジフルオロメチル、トリクロロメトキシ、トリフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、ジフルオロクロロメトキシまたはフェニルを表し、

n はまた好ましくは0または1の数を表し、そして

p はまた好ましくは0、1または2の数を表し、ここに

10

20

30

40

50

なる置換基で1～3置換されていてもよいフェニルを表すか、或いは場合によってはフッ素、塩素及び臭素よりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1～3置換されていてもよいベンジルを表し、

X^4 は好ましくはフッ素、塩素、臭素、ニトロ、メチル、エチル、*t*-ブチル、メトキシ、メチルチオ、トリクロロメチル、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメチルチオ、場合によってはフッ素、塩素、臭素及びメチルよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1または2置換されていてもよいフェニルを表すか、或いは場合によってはフッ素、塩素、臭素及びメチルよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1または2置換されていてもよいフェノキシを表し

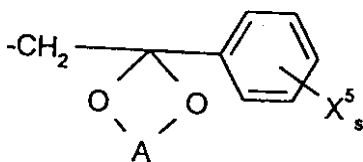
r は好ましくは0、1、2または3の数を表し、ここに

r が2または3を表す場合、 X^4 は同一もしくは相異なる基を表し、そして

Y^2 は好ましくは酸素原子を表すか、または CH_2 基を表す、

の基を表す。

R^1 は更に好ましくは式



式中、 A は好ましくは場合によってはフッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、*i*-ブチル、*s*-ブチル及び*t*-ブチルよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1～3置換されていてもよい炭素原子2または3個を有するアルカンジイルを表し、

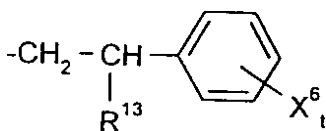
X^5 は好ましくはフッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、メトキシ、メチルチオ、トリクロロメチル、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチルチオ、ジフルオロメトキシ、場合によってはフッ素、塩素及びメチルよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1～3置換されていてもよいフェニルを表し、そして/ $または$ 場合によってはフッ素、塩素及びメチルよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1～3置換されていてもよいフェノキシを表し、

s は好ましくは0、1、2または3の数を表し、ここに

s が2または3を表す場合、 X^5 は同一もしくは相異なる基を表す、

の基を表す。

R^1 は更に好ましくは式



式中、 R^{13} は好ましくは炭素原子1～6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、炭素原子1～6個及びフッ素、塩素及び/ $または$ 臭素原子1～5個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のハロゲンアルキル、炭素原子1～3個並びにフルオロアルコキシ部分にフッ素原子1～5個及びアルキル部分に炭素原子1～3個を有するフルオロアルコキシアルキル、場合によってはフッ素、塩素、臭素、メチル及びエチルよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1～3置換されていてもよい炭素原子3～6個を有するシクロアルキル、シクロアルキル部分に炭素原子3～6個及びアルキル部分に炭素原子1～3個を有するシクロアルキルアルキル、場合によってはフッ素、塩素及び臭素よりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1～3置換されていてもよいフェニルを表すか、或いは場合によってはフッ素、塩素及び臭素よりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1～3置換されていてもよいアルキル部分に炭素原子1または2個を有するフェニルアルキルを表し、

X^6 は好ましくはフッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、*t*-ブチル、メトキシ、メチルチオ、トリクロロメチル、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、ジフルオロメト

10

20

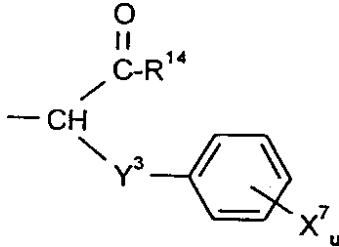
30

40

50

キシ、トリフルオロメチルチオ、場合によってはフッ素、塩素、臭素及びメチルよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1または2置換されていてもよいフェニルを表すか、或いは場合によってはフッ素、塩素、臭素及びメチルよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1または2置換されていてもよいフェノキシを表し、そして
 t は好ましくは0、1、2または3の数を表し、ここに
 t が2または3を表す場合、 X^6 は同一もしくは相異なる基を表す、
 の基を表す。

R^1 は更に好ましくは式



10

式中、 R^{14} は好ましくは炭素原子1~4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、炭素原子1~4個及びフッ素原子1~5個を有するフルオロアルキル、場合によってはフッ素、塩素、臭素、メチル及びエチルよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1~3置換されていてもよい炭素原子3~6個を有するシクロアルキル、シクロアルキル部分に炭素原子3~6個及びアルキル部分に炭素原子1~3個を有するシクロアルキルアルキル、場合によってはフッ素、塩素及び臭素よりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1~3置換されていてもよいフェニルを表すか、或いは場合によってはフッ素、塩素及び臭素よりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1~3置換されていてもよいベンジルを表し、

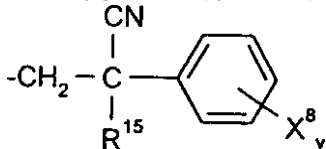
20

X^7 は好ましくはフッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、 t -ブチル、メトキシ、メチルチオ、トリクロロメチル、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメチルチオ、場合によってはフッ素、塩素、臭素及びメチルよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1または2置換されていてもよいフェニルを表すか、或いは場合によってはフッ素、塩素、臭素及びメチルよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1または2置換されていてもよいフェノキシを表し、

30

u は好ましくは0、1、2または3の数を表し、ここに
 u が2または3を表す場合、 X^7 は同一もしくは相異なる基を表し、そして
 Y^3 は好ましくは酸素原子を表すか、または CH_2 基を表す、
 の基を表す。

R^1 は更にまた好ましくは式



式中、 R^{15} は好ましくは炭素原子1~4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、炭素原子1~4個及びハロゲン原子1~5個を有するハロゲノアルキル、場合によってはハロゲン、炭素原子1~4個を有するアルキル、炭素原子1または2個及びハロゲン原子1~5個を有するハロゲノアルキル、炭素原子1~4個を有するアルコキシ並びに炭素原子1または2個及びハロゲン原子1~5個を有するハロゲノアルコキシよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1~3置換されていてもよいフェニルを表すか、或いは、場合によってはハロゲン、炭素原子1~4個を有するアルキル、炭素原子1または2個及びハロゲン原子1~5個を有するハロゲノアルキル、炭素原子1~4個を有するアルコキシ並びに炭素原子1または2個及びハロゲン原子1~5個を有するハロゲノアルコキシよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1~3置換されていてもよいアルキル部分に炭素原子1~4個を有するフェニルアルキルを表し、

40

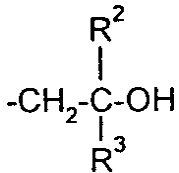
50

X^8 は好ましくはフッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、*t*-ブチル、メトキシ、メチルチオ、トリフルオロメチル、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメチルチオ、場合によってはフッ素、塩素、臭素及びメチルよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1または2置換されているもよいフェニルを表すか、或いは場合によってはフッ素、塩素、臭素及びメチルよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1または2置換されているもよいフェノキシを表し、そして

v は好ましくは0、1、2または3の数を表し、ここに

v が2または3を表す場合、 X^8 は同一もしくは相異なる基を表す、の基を表す。

R^1 は殊に好ましくは式



式中、 R^2 は殊に好ましくは炭素原子1~4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルを表し、ここにこれらの基はフッ素、塩素、臭素、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、アルコキシ部分に炭素原子1または2個を有するアルコキシイミノ、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル及びシクロヘキシルよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1~4置換されることができるか、

炭素原子2~5個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルケニルを表し、ここにこれらの基の各々はフッ素、塩素、臭素、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル及びシクロヘキシルよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1~3置換されることができるか、

炭素原子3~6個を有するシクロアルキルを表し、ここにこれらの基の各々はフッ素、塩素、臭素、シアノ、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル及び*t*-ブチルよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1~3置換されることができるか、

直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル部分に炭素原子1~4個を有するフェニルアルキルを表し、ここにフェニル部分はフッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、*t*-ブチル、メトキシ、エトキシ、メチルチオ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチルチオ、クロロジフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、クロロジフルオロメチルチオ、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、メトキシイミノメチル、1-メトキシイミノエチル、ニトロ及びシアノよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1~3置換されることができるか、

アルケニル部分に炭素原子2~4個を有するフェニルアルケニルを表し、ここにフェニル部分はフッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、*t*-ブチル、メトキシ、エトキシ、メチルチオ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチルチオ、クロロジフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、クロロジフルオロメチルチオ、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、メトキシイミノメチル、1-メトキシイミノエチル、ニトロ及びシアノよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1~3置換されることができるか、

直鎖状もしくは分枝鎖状のオキシアルキル部分に炭素原子1~4個を有するフェノキシアルキルを表し、ここにフェニル部分はフッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、*t*-ブチル、メトキシ、エトキシ、メチルチオ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチルチオ、クロロジフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、クロロジフルオロメチルチオ、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、メトキシイミノメチル、1-メトキシイミノエチル、ニトロ及びシアノよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1~3置換されることができるか、

フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、*t*-ブチル、メトキシ、エトキシ、メチルチオ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチルチオ、クロロジフルオ

10

20

30

40

50

ロメトキシ、ジフルオロメトキシ、クロロジフルオロメチルチオ、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、メトキシイミノメチル、1-メトキシイミノエチル、ニトロ及びシアノよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1~3置換されることができ、フェニルを表すか、或いは

ピラゾリル、イミダゾリル、1,2,4-トリアゾリル、ピロリル、フラニル、チエニル、チアゾリル、オキサゾリル、ピリジニル、ピリミジニル、トリアジニル、キノリニル、イソキノリニル、キナゾリニル、インドリル、ベンゾチエニル、ベンゾフラニル、ベンゾチアゾリルまたはベンゾイミダゾリルを表し、ここにこれらの基の各々はフッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、*t*-ブチル、メトキシ、エトキシ、メチルチオ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチルチオ、クロロジフルオロメトキシ、クロロジフルオロメチルチオ、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、炭素原子4~6個を有するヒドロキシアルキニル、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、メトキシイミノメチル、1-メトキシイミノエチル、ニトロ及びシアノ、ホルミル、ジメトキシメチル、アセチル並びにプロピオニルよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1~3置換されることができ、そして

R^3 は殊に好ましくは炭素原子1~4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルを表し、ここにこれらの基はフッ素、塩素、臭素、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、アルコキシ部分に炭素原子1または2個を有するアルコキシイミノ、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル及びシクロヘキシルよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1~4置換されることができ、

炭素原子2~5個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルケニルを表し、ここにこれらの基の各々はフッ素、塩素、臭素、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル及びシクロヘキシルよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1~3置換されることができ、

炭素原子3~6個を有するシクロアルキルを表し、ここにこれらの基の各々はフッ素、塩素、臭素、シアノ、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル及び*t*-ブチルよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1~3置換されることができ、

直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル部分に炭素原子1~4個を有するフェニルアルキルを表し、ここにフェニル部分はフッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、*t*-ブチル、メトキシ、エトキシ、メチルチオ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチルチオ、クロロジフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、クロロジフルオロメチルチオ、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、メトキシイミノメチル、1-メトキシイミノエチル、ニトロ及びシアノよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1~3置換されることができ、

アルケニル部分に炭素原子2~4個を有するフェニルアルケニルを表し、ここにフェニル部分はフッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、*t*-ブチル、メトキシ、エトキシ、メチルチオ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチルチオ、クロロジフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、クロロジフルオロメチルチオ、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、メトキシイミノメチル、1-メトキシイミノエチル、ニトロ及びシアノよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1~3置換されることができ、

直鎖状もしくは分枝鎖状のオキシアルキル部分に炭素原子1~4個を有するフェノキシアルキルを表し、ここにフェニル部分はフッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、*t*-ブチル、メトキシ、エトキシ、メチルチオ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチルチオ、クロロジフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、クロロジフルオロメチルチオ、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、メトキシイミノメチル、1-メトキシイミノエチル、ニトロ及びシアノよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1~3置換されることができ、

フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、*t*-ブチル、メトキシ、エトキシ、メチルチオ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチルチオ、クロロジフルオ

10

20

30

40

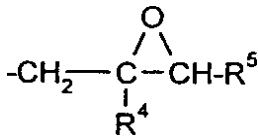
50

ロメトキシ、ジフルオロメトキシ、クロロジフルオロメチルチオ、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、メトキシイミノメチル、1-メトキシイミノエチル、ニトロ及びシアノよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1~3置換されることが出来るフェニルを表すか、或いは

ピラゾリル、イミダゾリル、1,2,4-トリアゾリル、ピロリル、フラニル、チエニル、チアゾリル、オキサゾリル、ピリジニル、ピリミジニル、トリアジニル、キノリニル、イソキノリニル、キナゾリニル、インドリル、ベンゾチエニル、ベンゾフラニル、ベンゾチアゾリルまたはベンゾイミダゾリルを表し、ここにこれらの基の各々はフッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、t-ブチル、メトキシ、エトキシ、メチルチオ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチルチオ、クロロジフルオロメトキシ、クロロジフルオロメチルチオ、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、炭素原子4~6個を有するヒドロキシアルキニル、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、メトキシイミノメチル、1-メトキシイミノエチル、ニトロ及びシアノ、ホルミル、ジメトキシメチル、アセチル並びにプロピオニルよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1~3置換されることが出来る、

の基を表す。

R¹は更に殊に好ましくは式

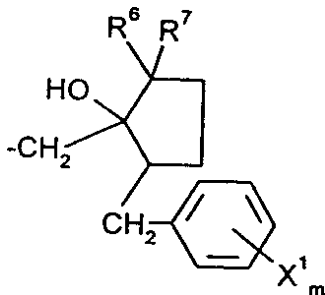


式中、R⁴は殊に好ましくはメチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、s-ブチル、イソブチル、t-ブチル、フルオロ-t-ブチル、ジフルオロ-t-ブチル、場合によってはフッ素、塩素及び臭素よりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1~3置換されていてもよい炭素原子3~6個を有するシクロアルキルを表すか、ナフチルを表すか、またはフッ素、塩素、臭素、ニトロ、フェニル、フェノキシ、メチル、エチル、t-ブチル、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、ジフルオロメチル、ジフルオロクロロメチル、トリフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ及びトリフルオロメチルチオよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1~3置換され得るフェニルを表し、そして

R⁵は殊に好ましくはフッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、イソプロピル、t-ブチル、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、ジフルオロメチル、ジフルオロクロロメチル、トリフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ及びトリフルオロメチルチオよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1~3置換され得るフェニルを表す、

の基を表す。

R¹は更に殊に好ましくは式



式中、R⁶は殊に好ましくは水素、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、イソブチル、s-ブチル、t-ブチルまたはn-ペンチルを表し、

R⁷は殊に好ましくは水素、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、イソブチル、s-ブチル、t-ブチルまたはn-ペンチルを表し、

X¹は殊に好ましくはフッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピ

10

20

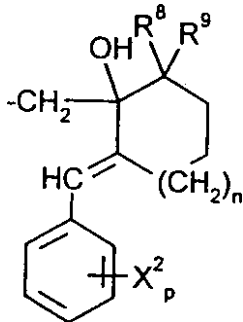
30

40

50

ル、*n*-ブチル、イソブチル、*s*-ブチル、*t*-ブチル、メトキシ、エトキシ、フェニル、フェノキシ、トリクロロメチル、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシまたはトリフルオロメチルチオを表し、そして *m* はまた殊に好ましくは 0、1 または 2 の数を表し、ここに *m* が 2 を表す場合、 X^1 は同一もしくは相異なる基を表し得る、の基を表す。

R^1 は更に殊に好ましくは式



10

式中、 R^8 は殊に好ましくは水素、メチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、イソブチル、*s*-ブチル、*t*-ブチルまたは *n*-ペンチルを表し、

R^9 は殊に好ましくは水素、メチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、イソブチル、*s*-ブチル、*t*-ブチルまたは *n*-ペンチルを表し、

20

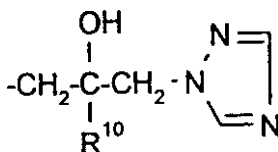
X^2 は殊に好ましくはフッ素、塩素、臭素、シアノ、ニトロ、メチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、イソブチル、*s*-ブチル、*t*-ブチル、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、ジフルオロメチル、トリクロロメトキシ、トリフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、ジフルオロクロロメトキシまたはフェニルを表し、

n はまた殊に好ましくは 0 または 1 の数を表し、そして

p はまた殊に好ましくは 0、1 または 2 の数を表し、ここに

p が 2 を表す場合、 X^2 は同一もしくは相異なる基を表すことができる、の基を表す。

R^1 は更に殊に好ましくは式



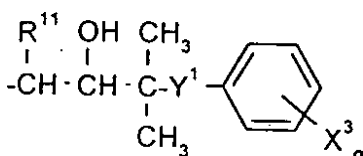
30

式中、 R^{10} は殊に好ましくはメチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、*s*-ブチル、イソブチル、*t*-ブチル、炭素原子 1~4 個及びフッ素、塩素及び/または臭素原子 1~3 個を有するハロゲノアルキル、各々場合によってはフッ素、塩素、臭素、メチル及びエチルよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で 1~3 置換されていてもよいシクロプロピル、シクロペンチル、シクロヘキシルを表し、そしてまたフェニル、ベンジルまたはフェネチルを表し、ここに 3 つの最後に示される基の各々はフェニル部分においてフッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、メトキシ、メチルチオ、トリクロロメチル、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメチルチオ、フェニル及びフェノキシよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で 1~3 置換され得る、

40

の基を表す。

R^1 は更に殊に好ましくは式



50

式中、 R^{11} は殊に好ましくは水素、炭素原子1～6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルを表すか、或いは各々場合によってはフッ素、塩素、臭素、メチル及びエチルよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1～3置換されているもよいシクロプロピル、シクロペンチル、シクロヘキシルを表し、

X^3 は殊に好ましくはフッ素、塩素、臭素、メチル、メトキシ、メチルチオ、トリクロロメチル、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメチルチオ、フェニルまたはフェノキシを表し、

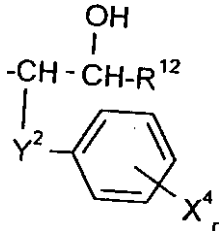
q はまた殊に好ましくは0、1、2または3の数を表し、ここに

q が2または3を表す場合、 X^3 は同一もしくは相異なる基を表し、そして

Y^1 はまた殊に好ましくは酸素原子、 CH_2 基または直接結合を表す、

の基を表す。

R^1 は更に殊に好ましくは式



式中、 R^{12} は殊に好ましくはメチル、イソプロピル、*t*-ブチル、フルオロ-*t*-ブチル、ジフルオロ-*t*-ブチル、各々場合によってはフッ素、塩素及びメチルよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1～3置換されているもよいシクロプロピル、シクロペンチルまたはシクロヘキシルを表すか、シクロアルキル部分に炭素原子3～6個及びアルキル部分に炭素原子1または2個を有するシクロアルキルアルキル、場合によってはフッ素、塩素及び臭素よりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1または2置換されているもよいフェニルを表すか、或いは場合によってはフッ素、塩素及び臭素よりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1または2置換されているもよいベンジルを表し、

X^4 は殊に好ましくはフッ素、塩素、臭素、ニトロ、メチル、エチル、*t*-ブチル、メトキシ、メチルチオ、トリクロロメチル、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメチルチオ、フェニルまたはフェノキシを表し、

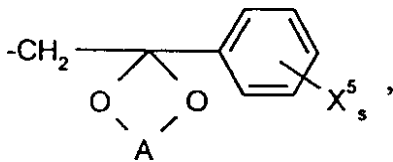
r はまた殊に好ましくは0、1、2または3の数を表し、ここに

r が2または3を表す場合、 X^4 は同一もしくは相異なる基を表し、そして

Y^2 はまた殊に好ましくは酸素原子を表すか、または CH_2 基を表す、

の基を表す。

R^1 は更に殊に好ましくは式



式中、 A は殊に好ましくは場合によってはフッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、*i*-ブチル、*s*-ブチル及び*t*-ブチルよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1～3置換されているもよい炭素原子2または3個を有するアルカンジイルを表し、

X^5 は殊に好ましくはフッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、メトキシ、メチルチオ、トリクロロメチル、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチルチオ、ジフルオロメトキシ、場合によってはフッ素、塩素及びメチルよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1～3置換されているもよいフェニルを表すか、そして/または場合によってはフッ素、塩素及びメチルよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1～3置換されているもよいフェノキシを表し、そして

s はまた殊に好ましくは0、1、2または3の数を表し、ここに

s が2または3を表す場合、 X^5 は同一もしくは相異なる基を表す、

10

20

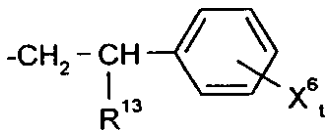
30

40

50

の基を表す。

R^1 は更に殊に好ましくは式

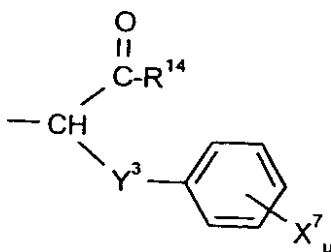


式中、 R^{13} は殊に好ましくはメチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、イソ-ブチル、*s*-ブチル、*t*-ブチル、炭素原子1~4個及びフッ素、塩素及び/または臭素原子1~5個を有するハロゲノアルキル、炭素原子1または2個並びにフルオロアルコキシ部分にフッ素原子1~5個及びアルキル部分に炭素原子1または2個を有するフルオロアルコキシアルキル、各々場合によってはフッ素、塩素及びメチルよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1~3置換されているもよいシクロプロピル、シクロペンチルまたはシクロヘキシルを表すか、シクロアルキル部分に炭素原子3~6個及びアルキル部分に炭素原子1または2個を有するシクロアルキルアルキル、場合によってはフッ素、塩素及び臭素よりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1または2置換されているもよいフェニルを表すか、或いは場合によってはフッ素、塩素及び臭素よりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1または2置換されているもよいベンジルを表し、 X^6 は殊に好ましくはフッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、*t*-ブチル、メトキシ、メチルチオ、トリクロロメチル、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメチルチオ、フェニルまたはフェノキシを表し、そして
 t はまた殊に好ましくは0、1、2または3の数を表し、ここに
 u が2または3を表す場合、 X^6 は同一もしくは相異なる基を表す、
の基を表す。

10

20

R^1 は更に殊に好ましくは式

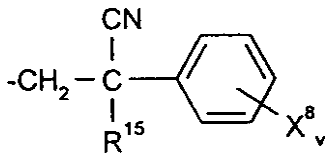


式中、 R^{14} は殊に好ましくはメチル、イソプロピル、*t*-ブチル、フルオロ-*t*-ブチル、ジフルオロ-*t*-ブチル、各々場合によってはフッ素、塩素及びメチルよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1~3置換されているもよいシクロプロピル、シクロペンチルまたはシクロヘキシルを表すか、シクロアルキル部分に炭素原子3~6個及びアルキル部分に炭素原子1または2個を有するシクロアルキルアルキルを表すか、場合によってはフッ素、塩素及び臭素よりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1または2置換されているもよいフェニルを表すか、或いは場合によってはフッ素、塩素及び臭素よりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1または2置換されているもよいベンジルを表し、
 X^7 は殊に好ましくはフッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、*t*-ブチル、メトキシ、メチルチオ、トリクロロメチル、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメチルチオ、フェニルまたはフェノキシを表し、
 Y^3 はまた殊に好ましくは酸素原子を表すか、または CH_2 基を表し、そして
 u はまた殊に好ましくは0、1、2または3の数を表し、ここに
 u が2または3を表す場合、 X^7 は同一もしくは相異なる基を表す、
の基を表す。

30

40

R^1 は更にまた好ましくは式



式中、 R^{15} は殊に好ましくはメチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、*s*-ブチル、イソ-ブチル、*t*-ブチル、フルオロ-*t*-ブチル、ジフルオロ-*t*-ブチル、場合によってはフッ素、塩素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメトキシ及びジフルオロメトキシよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1または2置換されているフェニルを表すか、或いは場合によってはフェニル部分においてフッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメトキシ及びジフルオロメトキシよりなる群からの同一もしくは相異なる置換基で1または2置換されているアルキル部分に炭素原子1または2個を有するフェニルアルキルを表し、 X^8 は殊に好ましくはフッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、*t*-ブチル、メトキシ、メチルチオ、トリクロロメチル、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメチルチオ、フェニルまたはフェノキシを表し、そして v はまた殊に好ましくは0、1、2または3の数を表し、ここに v が2または3を表す場合、 X^8 は同一もしくは相異なる基を表す、の基を表す。

10

本発明による他の好適な化合物は酸及び R^1 がこの置換基に対して殊に好適なものとして既に挙げられた意味を有する式(I)のチオシアナト-トリアゾリル誘導体の付加生成物である。

20

付加反応させ得る酸には好ましくはハロゲン化水素酸例えば塩酸及び臭化水素酸、殊に塩酸、更にリン酸、硝酸、一及び二官能性のカルボン酸及びヒドロキシカルボン酸例えば酢酸、マレイン酸、コハク酸、フマル酸、酒石酸、クエン酸、サリチル酸、ソルビン酸及び乳酸、並びにまたスルホン酸例えば

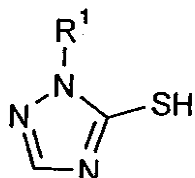
-トルエンスルホン酸及び1,5-ナフタレンジスルホン酸、並びにまたサッカリン及びチオサッカリンが含まれる。

本発明による他の好適な化合物は元素の周期表のI I ~ I V主族並びにI及びI I並びにI V ~ V I I I亜族の金属の塩並びに R^1 がこの置換基に対して好適なものとして挙げられた意味を有する式(I)のチオシアナト-トリアゾリル誘導体の付加生成物である。

30

これに関連して銅、亜鉛、マンガン、マグネシウム、スズ、鉄及びニッケルの塩が殊に好ましい。これらの塩の適当な陰イオンは生理学的に許容し得る付加生成物を生じさせる酸から誘導されるものである。これに関連して、殊に好適なこのタイプの酸にはハロゲン化水素酸例えば塩酸及び臭化水素酸、更にリン酸、硝酸及び硫酸がある。

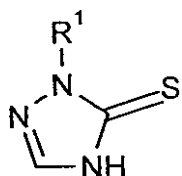
本発明による物質を製造するために出発物質として必要とされるメルカプト-トリアゾールは式



(II)

40

の「メルカプト」形、または式

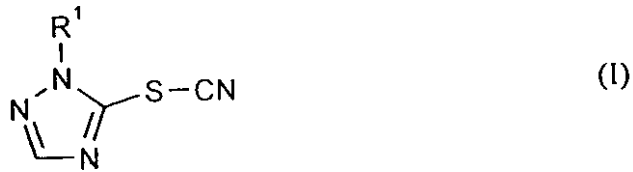


(IIa),

の互変異性の「チオノ」形で存在し得る。

従って、本発明による物質のあるものまたは全てを式(I I a)の「チオノ」形から誘導することを除外することはできない。このことは、本発明による物質が式

50



(「メルカプト」形)

または式

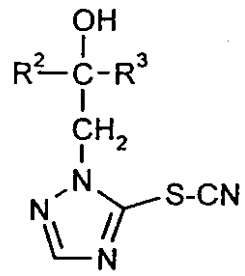


10

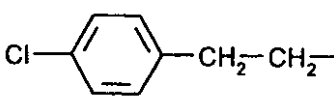
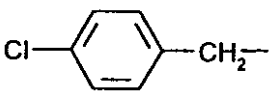
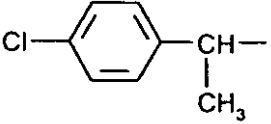
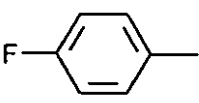
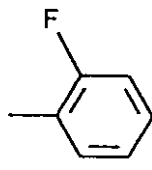
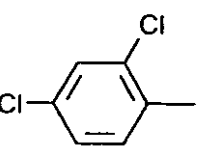
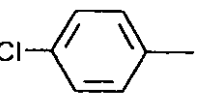
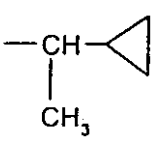
(「チオノ」形)

の物質、或いは式 (I) 及び (I a) の物質の混合物のいずれかとして存在することを意味する。簡単のために、「メルカプト」形の構造のみを各々の場合に示す。 20
下の表中に示されるチオシアナト - トリアゾリル誘導体は本発明による物質の例である。

表 1



(Ib)

R ²	R ³
	-C(CH ₃) ₃
	-C(CH ₃) ₃
	-C(CH ₃) ₃
	
	-C ₄ H _{9-n}
	

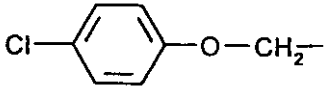

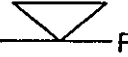
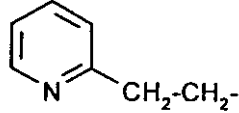
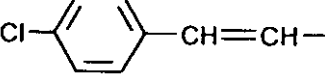
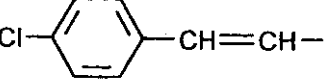
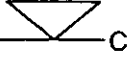
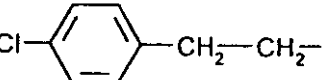

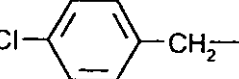

10

20

30

40

表 1 - 続

R ²	R ³
	-C(CH ₃) ₃
Cl ₂ CH-CCl ₂ -CH ₂ -	-C(CH ₃) ₃
Cl ₂ CH-CCl ₂ -CH ₂ -	
Cl ₂ CH-CCl ₂ -CH ₂ -	
	-C(CH ₃) ₃
	-C(CH ₃) ₃
	
	
	

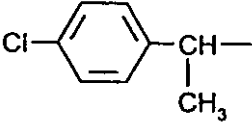
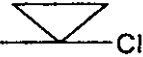
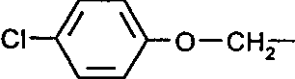

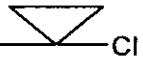
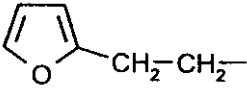
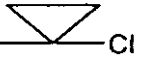
10

20

30

40

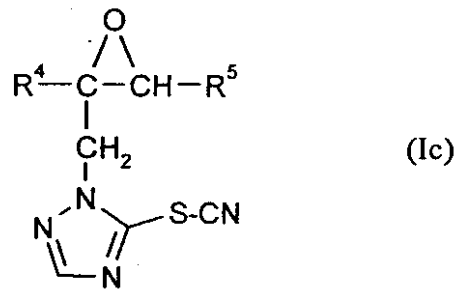
表 1 - 続

R ²	R ³
	
	
$\text{Cl}_2\text{CH}-\text{CCl}_2-$	
	$-\text{C}(\text{CH}_3)_3$
$\text{Cl}_2\text{C}=\text{CCl}-\text{CH}_2-$	

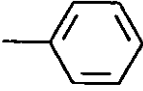
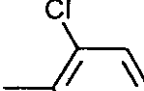
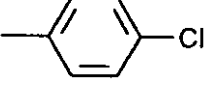
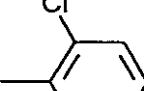
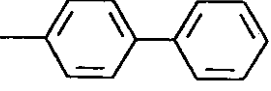
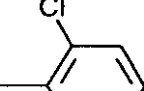
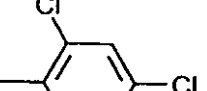
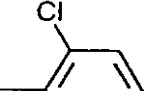
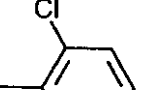
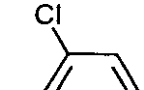
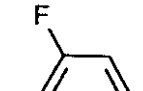
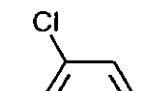
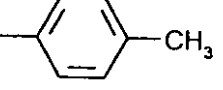
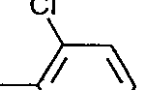
10

20

表 2



10

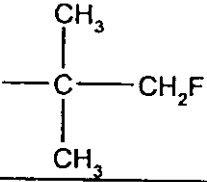
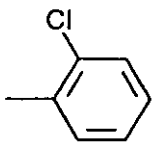
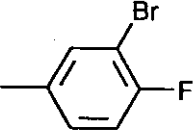
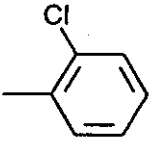
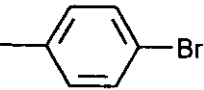
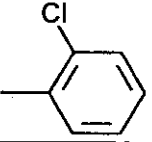
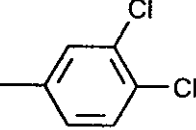
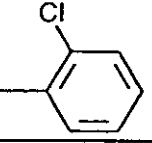
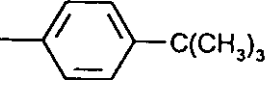
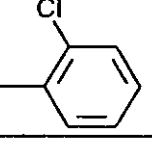
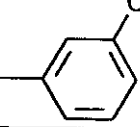
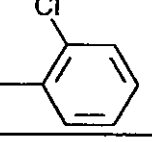
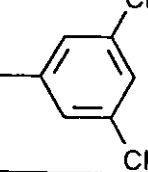
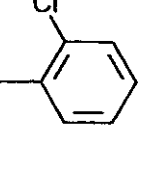
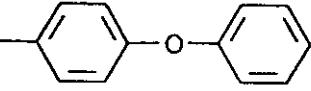
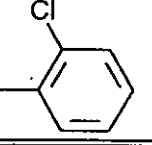
R ⁴	R ⁵
	
	
	
	
	
	
	

20

30

40

表 2-続

R ⁴	R ⁵
	
	
	
	
	
	
	
	

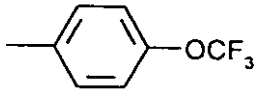
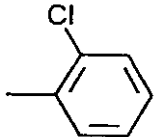
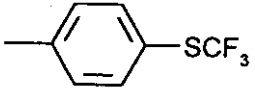
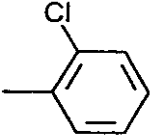

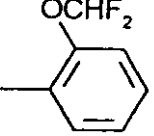
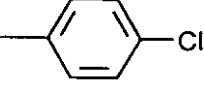
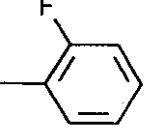
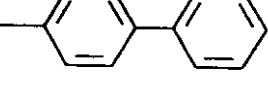
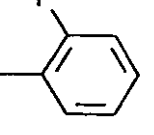
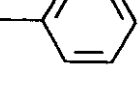
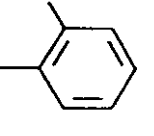
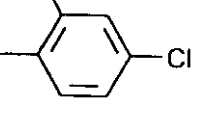
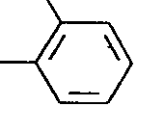
10

20

30

40

表 2 - 続

R ⁴	R ⁵
	
	
	
	
	
	
	

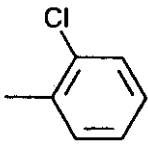
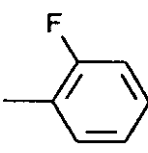
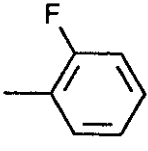
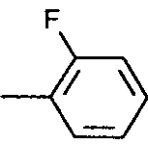
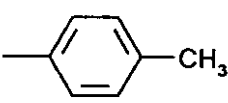
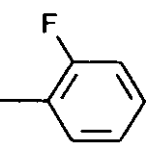
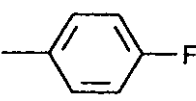
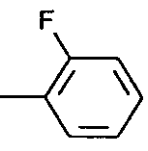
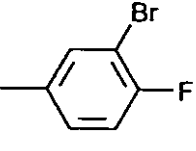
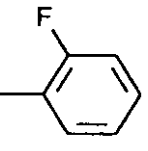
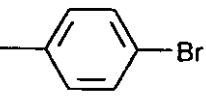
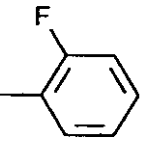
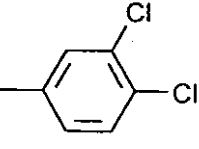
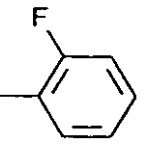
10

20

30

40

表 2-続

R ⁴	R ⁵
	
	
	
	
	
	
	

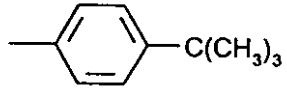
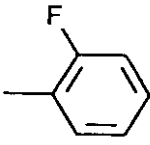
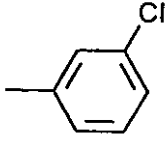
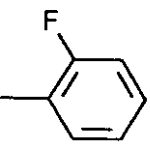
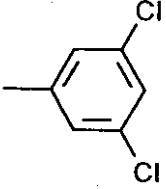
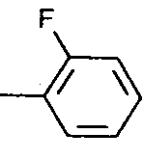
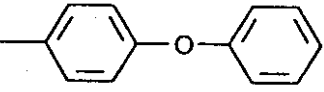
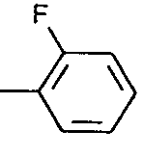
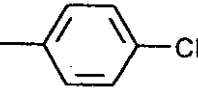
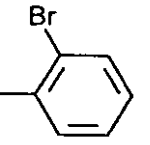
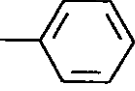
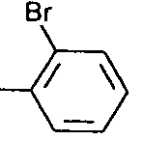
10

20

30

40

表 2-続

R ⁴	R ⁵
	
	
	
	
	
	

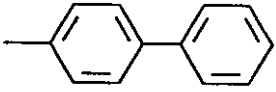
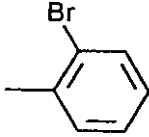
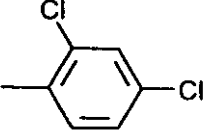
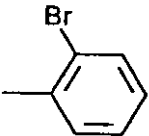
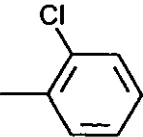
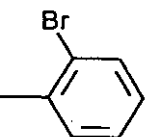
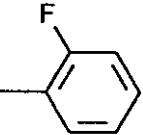
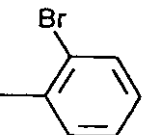
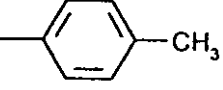
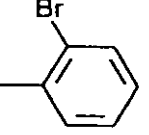
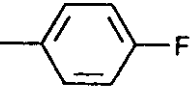
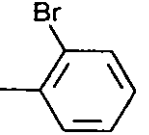
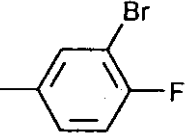
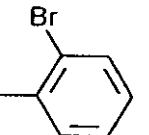
10

20

30

40

表 2-続

R ⁴	R ⁵
	
	
	
	
	
	
	

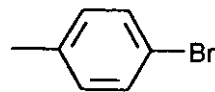
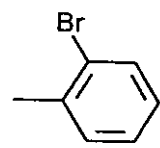
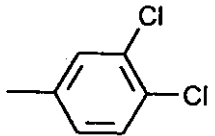
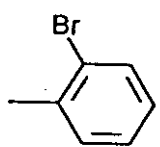
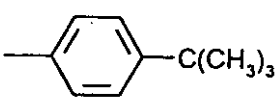
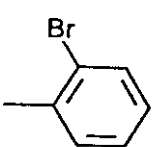
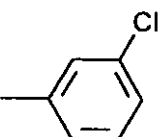
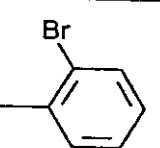
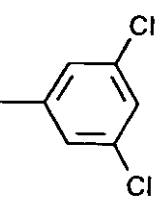
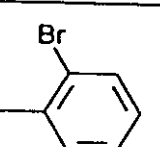
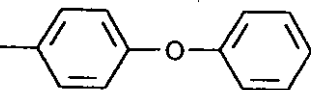
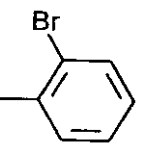
10

20

30

40

表 2-続

R ⁴	R ⁵
	
	
	
	
	
	

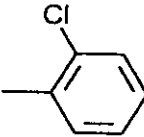
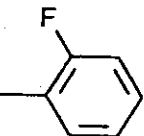
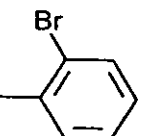
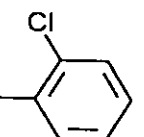
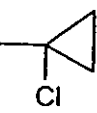
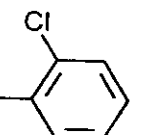
10

20

30

40

表 2 - 続

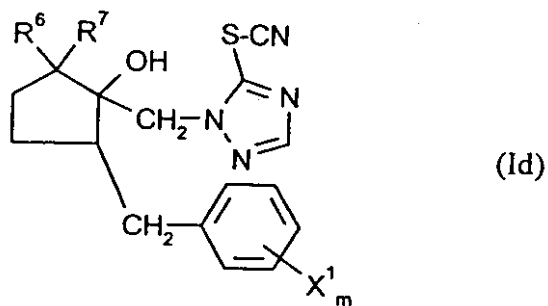
R ⁴	R ⁵
-CH ₃	
-CH ₃	
-CH ₃	
-C(CH ₃) ₃	
	

10

20

30

表-3



R ⁶	R ⁷	X ¹ _m
-CH ₃	-CH ₃	4-Br
-CH ₃	-CH ₃	4-F
-CH ₃	-CH ₃	2,4-Cl ₂
-CH ₃	H	4-Cl
-CH ₃	-CH ₃	-
-CH ₃	-CH ₃	4-CH ₃
-CH ₃	-CH ₃	2-F, 4-Cl
-C ₂ H ₅	H	4-Cl
-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	4-Cl
-C ₃ H _{7-n}	H	4-Cl
-C ₂ H ₅	H	2,4-Cl ₂
-C ₂ H ₅	H	4-F
-C ₂ H ₅	H	4-Br
-C ₂ H ₅	H	
-C ₂ H ₅	H	4-C ₄ H _{9-t}
-C ₃ H _{7-i}	H	4-Cl
-C ₅ H _{11-n}	H	4-Cl
-CH ₃	-CH ₃	
-CH ₃	-CH ₃	4-C ₄ H _{9-t}
-C ₄ H _{9-n}	H	4-Cl
-C ₄ H _{9-i}	H	4-Cl
-CH ₃	-C ₂ H ₅	4-Cl

10

20

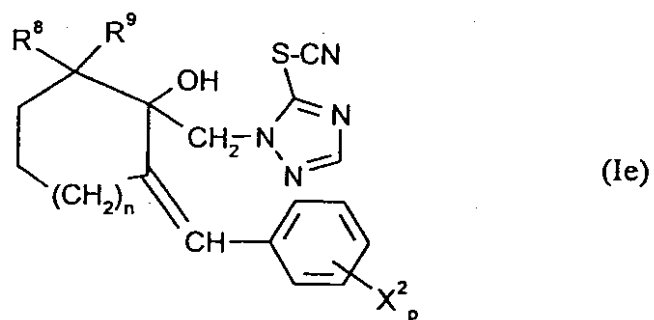
30

40

表 3 - 続

R ⁶	R ⁷	X _m ¹
-CH ₃	-CH ₃	2-Cl
-CH ₃	-CH ₃	2,3-Cl ₂
-CH ₃	-CH ₃	4-CF ₃
-CH ₃	-CH ₃	4-OCF ₃
-CH ₃	-CH ₃	4-Cl

表 4



R ⁸	R ⁹	X _p ²	n
-CH ₃	-CH ₃	4-Br	0
-CH ₃	-CH ₃	4-F	0
-CH ₃	-CH ₃	2,4-Cl ₂	0
-CH ₃	H	4-Cl	0
-CH ₃	-CH ₃	-	0
-CH ₃	-CH ₃	4-CH ₃	0
-CH ₃	-CH ₃	2-F, 4-Cl	0
-C ₂ H ₅	H	4-Cl	0
-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	4-Cl	0
-C ₃ H _{7-n}	H	4-Cl	0
-C ₂ H ₅	H	2,4-Cl ₂	0
-C ₂ H ₅	H	4-F	0
-C ₂ H ₅	H	4-Br	0
-C ₂ H ₅	H	4-NO ₂	0
-C ₂ H ₅	H	4-C ₄ H _{9-t}	0
-C ₃ H _{7-i}	H	4-Cl	0
-C ₃ H _{11-n}	H	4-Cl	0
-CH ₃	-CH ₃	4-CN	0
-CH ₃	-CH ₃	4-C ₄ H _{9-t}	0
-C ₄ H _{9-n}	H	4-Cl	0
-C ₄ H _{9-i}	H	4-Cl	0
-CH ₃	-C ₂ H ₅	4-Cl	0

10

20

30

40

表 4 - 続

R ⁸	R ⁹	X _p ²	n
-CH ₃	-CH ₃	4-OCH ₃	0
-CH ₃	-CH ₃	2-OCH ₃	0
-CH ₃	-CH ₃	2-CF ₃	0
-CH ₃	-CH ₃	4-CF ₃	0
-CH ₃	-CH ₃	2-OCF ₃	0
-CH ₃	-CH ₃	2-OCHF ₂	0
-CH ₃	-CH ₃	4-OCF ₃	0
-CH ₃	-CH ₃	4-Br	1
-CH ₃	-CH ₃	4-F	1
-CH ₃	-CH ₃	2,4-Cl ₂	1
-CH ₃	H	4-Cl	1
-CH ₃	-CH ₃	-	1
-CH ₃	-CH ₃	4-CH ₃	1
-CH ₃	-CH ₃	2-F, 4-Cl	1
-C ₂ H ₅	H	4-Cl	1
-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	4-Cl	1
-C ₃ H _{7-n}	H	4-Cl	1
-C ₂ H ₅	H	2,4-Cl ₂	1
-C ₂ H ₅	H	4-F	1
-C ₂ H ₅	H	4-Br	1
-C ₂ H ₅	H	4-NO ₂	1
-C ₂ H ₅	H	4-C ₄ H _{9-t}	1
-C ₃ H _{7-i}	H	4-Cl	1
-C ₅ H _{11-n}	H	4-Cl	1
-CH ₃	-CH ₃	4-CN	1

10

20

30

40

表 4 - 続

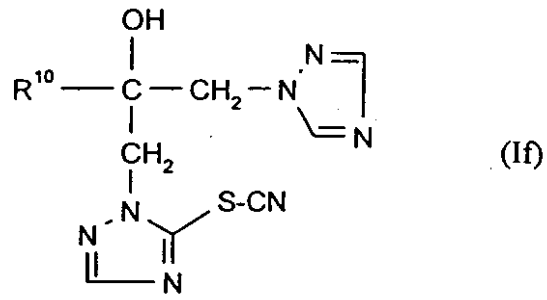
R ⁸	R ⁹	X _p ²	n
-CH ₃	-CH ₃	4-C ₄ H ₉ -t	1
-C ₄ H ₉ -n	H	4-Cl	1
-CH ₃	-CH ₃	4-Cl	1
-CH ₃	-CH ₃	4-OCH ₃	1
-CH ₃	-CH ₃	2-OCH ₃	1
-CH ₃	-CH ₃	2-CF ₃	1
-CH ₃	-CH ₃	4-CF ₃	1
-CH ₃	-CH ₃	2-OCF ₃	1
-CH ₃	-CH ₃	2-OCHF ₂	1
-CH ₃	-CH ₃	4-OCF ₃	1
-CH ₃	-CH ₃	2-Cl	0
-CH ₃	-CH ₃	2,3-Cl ₂	0
-CH ₃	-CH ₃	2-Cl	1
-CH ₃	-CH ₃	4-Cl	0

10


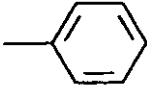

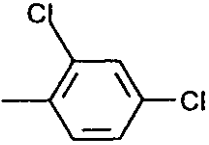
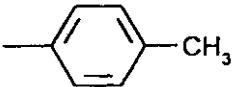
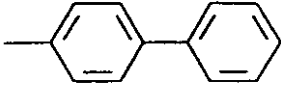
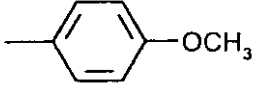
20

30

表 5



10

R ¹⁰








20

30

40

表 5 - 続

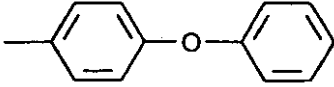
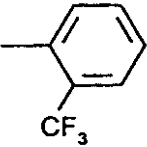
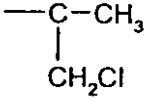
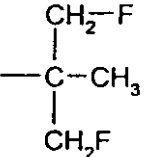

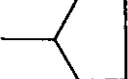
R^{10}	
	10
	
$-C_4H_9-n$	
$-C(CH_3)_3$	20
$-CH(CH_2CO_2)$	
	
	30
$-CH_2-CH(CH_3)_2$	
	
	40

表 5 - 続

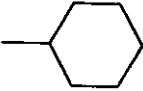
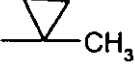
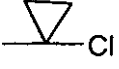
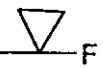
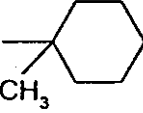
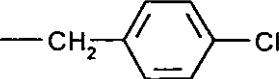
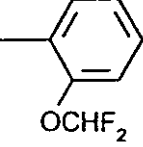
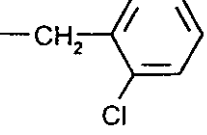
R^{10}	
	10
	
	
	20
	
	30
	
	40

表 5-続

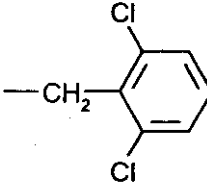
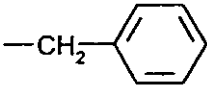
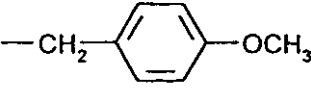
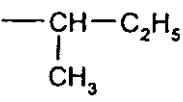
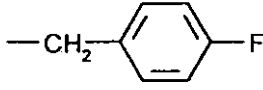
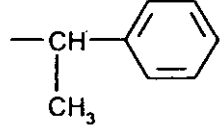
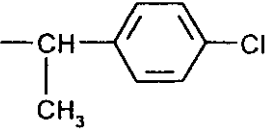
R ¹⁰	
	10
	
	20
	
	30
	
	40

表 5 - 続

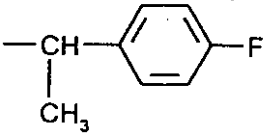
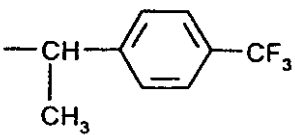
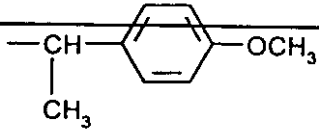
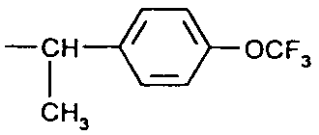
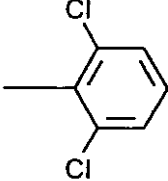
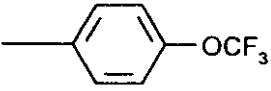
R ¹⁰	
	10
	
	20
	
	30
	40

表 5 - 続

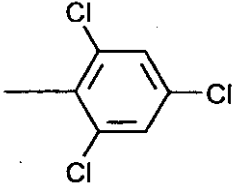
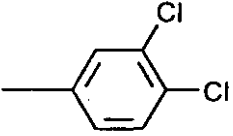
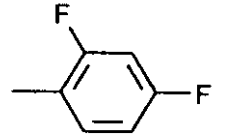
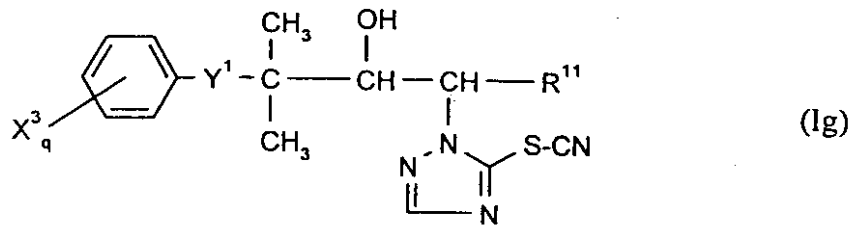
R^{10}	
	10
	20
	

表-6



X^3_q	Y^1	R^{11}
4-Cl	CH_2	H
4- CF_3	CH_2	H
4- OCF_3	CH_2	H
2,4- Cl_2	CH_2	H
4- CH_3	CH_2	H
2-Cl	CH_2	H
2-F	CH_2	H
4-F	CH_2	H
2- $OCHF_2$	CH_2	H
4-Cl	O	H
4- CF_3	O	H
4- OCF_3	O	H
2,4- Cl_2	O	H
4- CH_3	O	H
2-Cl	O	H
2-F	O	H
4-F	O	H
2- $OCHF_2$	O	H

10

20

30

40

表 6 - 続,

X^3	Y^1	R^{11}
4-Cl	-	H
4-CF ₃	-	H
4-OCF ₃	-	H
2,4-Cl ₂	-	H
4-CH ₃	-	H
2-Cl	-	H
2-F	-	H
4-F	-	H
2-OCHF ₂	-	H
4-Cl	CH ₂	-CH ₃
4-CF ₃	CH ₂	-CH ₃
4-OCF ₃	CH ₂	-CH ₃
2,4-Cl ₂	CH ₂	-CH ₃
4-CH ₃	CH ₂	-CH ₃
2-Cl	CH ₂	-CH ₃
2-F	CH ₂	-CH ₃
4-F	CH ₂	-CH ₃
2-OCHF ₂	CH ₂	-CH ₃
4-Cl	O	-CH ₃
4-CF ₃	O	-CH ₃
2,4-Cl ₂	O	-CH ₃
4-OCF ₃	O	-CH ₃
2-F	O	-CH ₃

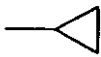
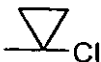
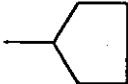
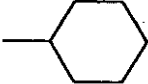
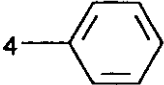
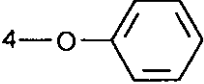
10

20

30

40

表 6-続

X^3	Y^1	R^{11}
2-OCHF ₂	O	-CH ₃
4-Cl	-	-CH ₃
4-CF ₃	-	-CH ₃
2,4-Cl ₂	-	-CH ₃
4-OCF ₃	-	-CH ₃
2-F	-	-CH ₃
2-OCHF ₂	-	-CH ₃
4-Cl	CH ₂	C ₄ H ₉ -n
2,4-Cl ₂	CH ₂	-CH(CH ₃) ₂
4-OCF ₃	CH ₂	-C(CH ₃) ₃
4-Cl	CH ₂	
4-Cl	CH ₂	
4-Cl	CH ₂	
4-Cl	CH ₂	
2,4,6-Cl ₃	CH ₂	-CH ₃
	CH ₂	-CH ₃
	CH ₂	-CH ₃

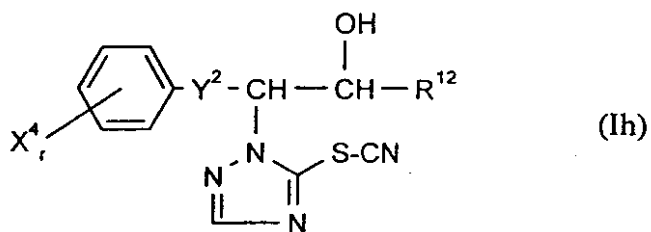
10

20

30

40

表 7



X^4	R^{12}	Y^2
2,4-Cl ₂		O
4-Cl		O
4-Br	-C(CH ₃) ₃	O
-	-C(CH ₃) ₃	O
4-C(CH ₃) ₃	-C(CH ₃) ₃	O
2-Cl	-C(CH ₃) ₃	O
3-Cl	-C(CH ₃) ₃	O
4-F	-C(CH ₃) ₃	O
	-C(CH ₃) ₃	O
	-C(CH ₃) ₃	O
2,4-Cl ₂	-C(CH ₃) ₃	O
2-CH ₃ , 4-Cl	-C(CH ₃) ₃	O

10

20

30

40

表 7-続

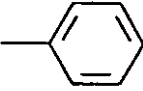
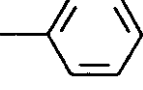


X ⁴	R ¹²	Y ²
3,4-(CH ₃) ₂	-C(CH ₃) ₃	
2,4,5-Cl ₃	-C(CH ₃) ₃	O
4-Cl	-CH ₃	O
4-Cl	$-\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_5$	O
4-CF ₃	-C(CH ₃) ₃	O
4-OCF ₃	-C(CH ₃) ₃	O
2-OCHF ₂	-C(CH ₃) ₃	O
4-OCH ₃	-C(CH ₃) ₃	O
4-Cl	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{C}-\text{CH}_2\text{F} \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	O
4-Cl	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{C}-\text{CH}_3 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	O O

10

20

30

表 7 - 続

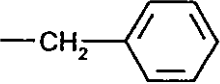
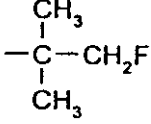
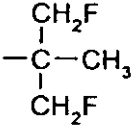
X^4	R^{12}	Y^2
2,4-Cl ₂		CH ₂
4-Cl		CH ₂
4-Br	-C(CH ₃) ₃	CH ₂
-	-C(CH ₃) ₃	CH ₂
4-C(CH ₃) ₃	-C(CH ₃) ₃	CH ₂
2-Cl	-C(CH ₃) ₃	CH ₂
3-Cl	-C(CH ₃) ₃	CH ₂
4-F	-C(CH ₃) ₃	CH ₂
4- 	-C(CH ₃) ₃	CH ₂
2- 	-C(CH ₃) ₃	CH ₂
2,4-Cl ₂	-C(CH ₃) ₃	CH ₂
2-CH ₃ , 4-Cl	-C(CH ₃) ₃	CH ₂

10

20

30

表 7-続

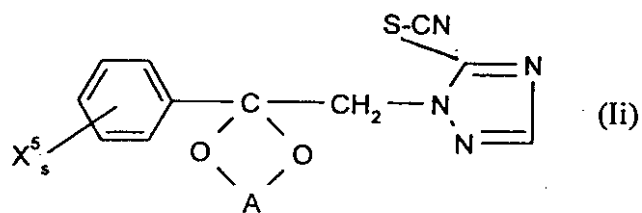
X^4	R^{12}	Y^2
3,4-(CH ₃) ₂	-C(CH ₃) ₃	CH ₂
2,4,5-Cl ₃	-C(CH ₃) ₃	CH ₂
4-Cl	-CH ₃	CH ₂
4-Cl		CH ₂
4-CF ₃	-C(CH ₃) ₃	CH ₂
4-OCF ₃	-C(CH ₃) ₃	CH ₂
2-OCHF ₂	-C(CH ₃) ₃	CH ₂
4-OCH ₃	-C(CH ₃) ₃	CH ₂
4-Cl		CH ₂
4-Cl		CH ₂
4-Cl	-C(CH ₃) ₃	O

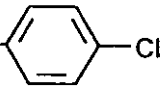
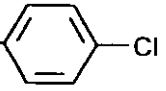
10

20

30

表 8



X^s	A
2,4-Cl ₂	-(CH ₂) ₃ -
2,4-Cl ₂	-(CH ₂) ₂ -
4-Cl	$\begin{array}{c} \text{CH}_2 - \text{CH} - \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$
4-CF ₃	$\begin{array}{c} -\text{CH}_2 - \text{CH} - \\ \\ \text{C}_3\text{H}_7 - n \end{array}$
2-Cl, 4-O- 	-CH ₂ -CH ₂ -
2-Cl, 4-O- 	$\begin{array}{c} -\text{CH}_2 - \text{CH} - \\ \\ \text{C}_2\text{H}_5 \end{array}$
4-F	$\begin{array}{c} -\text{CH}_2 - \text{CH} - \\ \\ \text{C}_3\text{H}_7 - n \end{array}$
4-OCF ₃	$\begin{array}{c} -\text{CH}_2 - \text{CH} - \\ \\ \text{C}_3\text{H}_7 - n \end{array}$

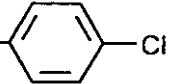
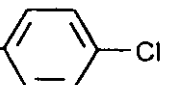
10

20

30

40

表 8 - 続 1

X ^s	A
2,4-F ₂	$\begin{array}{c} \text{---CH}_2\text{---CH---} \\ \\ \text{C}_3\text{H}_7\text{---n} \end{array}$
2-OCHF ₂	$\begin{array}{c} \text{---CH}_2\text{---CH---} \\ \\ \text{C}_3\text{H}_7\text{---n} \end{array}$
2-Cl, 4-O-  -Cl	-(CH ₂) ₃ -
2,4,6-Cl ₃	$\begin{array}{c} \text{CH}_2\text{---CH} \\ \\ \text{C}_3\text{H}_7\text{---n} \end{array}$
-	$\begin{array}{c} \text{---CH}_2\text{---CH---} \\ \\ \text{C}_3\text{H}_7\text{---n} \end{array}$
2,4-F ₂	$\begin{array}{c} \text{---CH}_2\text{---CH---} \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$
2-Cl, 4-O-  -Cl	$\begin{array}{c} \text{---CH}_2\text{---CH---} \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$
2,4-Cl ₂	$\begin{array}{c} \text{---CH---CH---} \\ \quad \\ \text{CH}_3 \quad \text{CH}_3 \end{array}$

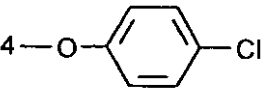
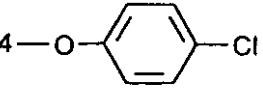
10

20

30

40

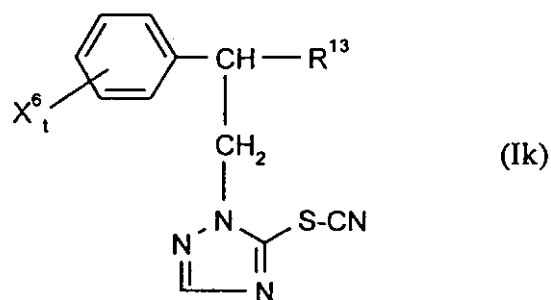
表 8-続

X ^s	A
2-Cl, 	$\begin{array}{c} \text{---CH---CH---} \\ \quad \\ \text{CH}_3 \quad \text{CH}_3 \end{array}$
2,4-Cl ₂	$\begin{array}{c} \text{---CH}_2\text{---CH---} \\ \\ \text{F} \end{array}$
2-Cl, 	$\begin{array}{c} \text{---CH}_2\text{---CH---} \\ \\ \text{C}_4\text{H}_9\text{---n} \end{array}$
2,4-Cl ₂	$\begin{array}{c} \text{---CH}_2\text{---CH---} \\ \\ \text{C}_2\text{H}_5 \end{array}$
2,4-Cl ₂	$\begin{array}{c} \text{---CH}_2\text{---CH---} \\ \\ \text{C}_3\text{H}_7\text{---n} \end{array}$

10

20

表 9



X^6_t	R^{13}
2,4-Cl ₂	-CH ₃
2,4-Cl ₂	-C ₂ H ₅
2,4-Cl ₂	-CH(CH ₃) ₂
4-Cl	-C ₃ H _{7-n}
2,4-Cl ₂	-C ₄ H _{9-n}
2,4-Cl ₂	$\begin{array}{c} \text{---CH---C}_2\text{H}_5 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$
2,4-Cl ₂	-C(CH ₃) ₃
2-Cl	-C ₃ H _{7-n}
2-OCF ₃	-C ₃ H _{7-n}
4-CF ₃	-C ₃ H _{7-n}
4-CH ₃	-C ₃ H _{7-n}
2,4,6-Cl ₃	-C ₃ H _{7-n}
2,4-Cl ₂	
4-F	-C ₃ H _{7-n}
2,4-Cl ₂	

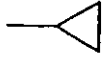
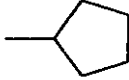
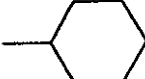
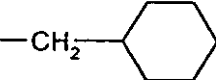
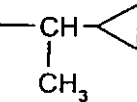
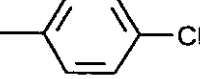


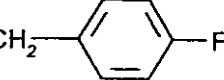
10

20

30

40

表 9-続

X_1^6	R^{13}
2,4-Cl ₂	
2,4-Cl ₂	
2,4-Cl ₂	
2,4-Cl ₂	
2,4-Cl ₂	
2,4-Cl ₂	
2,4-Cl ₂	
2,4-Cl ₂	
2,4-Cl ₂	
2,4-Cl ₂	-CH ₂ -O-CF ₂ -CHF ₂

10

20

30

40

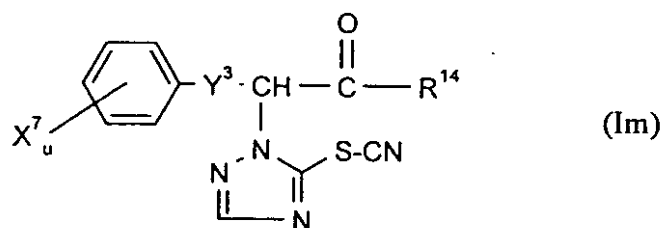
表 9 - 続

X_1^6	R^{13}
2,4-Cl ₂	-CH ₂ -O-CF ₂ -CH ₃
4-Cl	-CH ₂ -O-CF ₂ -CHF ₂
2,4-Cl ₂	-CH ₂ -O-CF ₃
4-F	-CH ₂ -O-CF ₂ -CHF ₂
2-Cl	-CH ₂ -O-CF ₂ -CHF ₂
2,4-Cl ₂	-CH ₂ -CF ₃
2,4-Cl ₂	-CF ₂ -CF ₃
2,4-Cl ₂	-C ₃ H _{7-n}

10

20

表 10



X_u^7	R^{14}	Y^3
2,4-Cl ₂		O
4-Cl		O
4-Br	-C(CH ₃) ₃	O
-	-C(CH ₃) ₃	O
4-C(CH ₃) ₃	-C(CH ₃) ₃	O
2-Cl	-C(CH ₃) ₃	O
3-Cl	-C(CH ₃) ₃	O
4-F	-C(CH ₃) ₃	O
	-C(CH ₃) ₃	O
	-C(CH ₃) ₃	O
2,4-Cl ₂	-C(CH ₃) ₃	O
2-CH ₃ , 4-Cl	-C(CH ₃) ₃	O

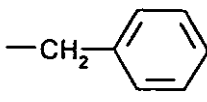
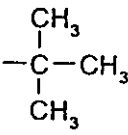
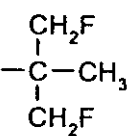
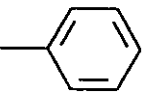
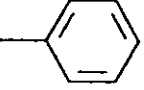
10

20

30

40

表 10-続

X^7	R^{14}	Y^3
3,4-(CH ₃) ₂	-C(CH ₃) ₃	O
2,4,5-Cl ₃	-C(CH ₃) ₃	O
4-Cl	-CH ₃	O
4-Cl		O
4-CF ₃	-C(CH ₃) ₃	O
4-OCF ₃	-C(CH ₃) ₃	O
2-OCHF ₂	-C(CH ₃) ₃	O
4-OCH ₃	-C(CH ₃) ₃	O
4-Cl		O
4-Cl		O
2,4-Cl ₂		CH ₂
4-Cl		CH ₂

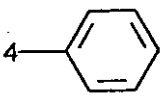
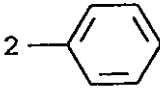

10

20

30

40

表 10-続

X^7	R^{14}	Y^3
4-Br	$-C(CH_3)_3$	CH_2
-	$-C(CH_3)_3$	CH_2
4- $C(CH_3)_3$	$-C(CH_3)_3$	CH_2
2-Cl	$-C(CH_3)_3$	CH_2
3-Cl	$-C(CH_3)_3$	CH_2
4-F	$-C(CH_3)_3$	CH_2
4- 	$-C(CH_3)_3$	CH_2
2- 	$-C(CH_3)_3$	CH_2
2,4- Cl_2	$-C(CH_3)_3$	CH_2
2- CH_3 , 4-Cl	$-C(CH_3)_3$	CH_2
3,4- $(CH_3)_2$	$-C(CH_3)_3$	CH_2
2,4,5- Cl_3	$-C(CH_3)_3$	CH_2
4-Cl	$-CH_3$	CH_2
4-Cl	$-CH_2-$ 	CH_2
4- CF_3	$-C(CH_3)_3$	CH_2
4- OCF_3	$-C(CH_3)_3$	CH_2
2- $OCHF_2$	$-C(CH_3)_3$	CH_2
4- OCH_3	$-C(CH_3)_3$	CH_2

10

20

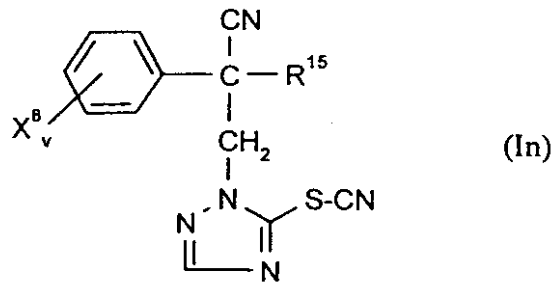
30

40

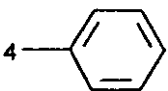
表 10-続

X'_u	R^{14}	Y^3
4-Cl	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{C}-\text{CH}_2\text{F} \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	CH_2
4-Cl	$\begin{array}{c} \text{CH}_2\text{F} \\ \\ -\text{C}-\text{CH}_3 \\ \\ \text{CH}_2\text{F} \end{array}$	CH_2
4-Cl	$-\text{C}(\text{CH}_3)_3$	O

表 11



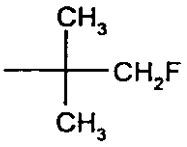
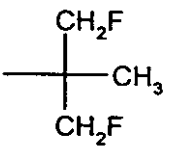
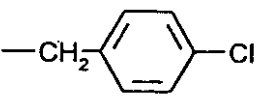
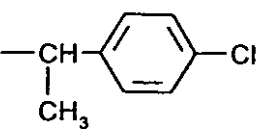
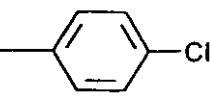
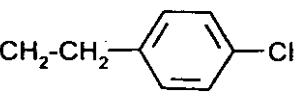
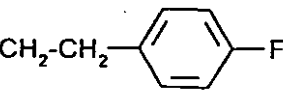
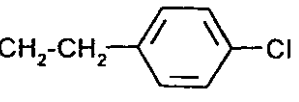
10

X^8_v	R^{15}
4-Cl	$-C_4H_9-n$
2-Cl	$-C_4H_9-n$
2,4-Cl ₂	$-C_4H_9-n$
4-Br	$-C_4H_9-n$
4-F	$-C_4H_9-n$
4-C(CH ₃) ₃	$-C_4H_9-n$
4- 	$-C_4H_9-n$
4-Cl	$-C(CH_3)_3$
2-Cl	$-C(CH_3)_3$
2,4-Cl ₂	$-C(CH_3)_3$
2,4,6-Cl ₃	$-C(CH_3)_3$
4-CF ₃	$-C(CH_3)_3$
2-OCHF ₂	$-C(CH_3)_3$

20

30

40

X_v^8	R^{15}
4-Cl	
4-Cl	
4-Cl	
4-Cl	
4-Cl	
4-Cl	
-	
-	

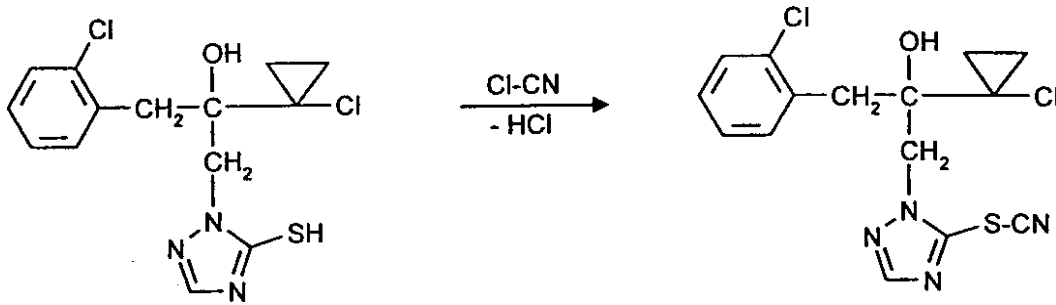
10

20

30

40

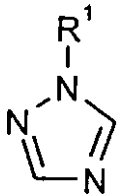
出発物質として 2 - (1 - クロロ - シクロプロピル) - 1 - (2 - クロロ - フェニル) - 3 - (5 - メルカプト - 1 , 2 , 4 - トリアゾル - 1 - イル) - プロパン - 2 - オール及び反応成分として新たに調製したクロロシアンを用い、本発明による工程の経路は下の式により表示得る。



式(II)は本発明による方法を行うための出発物質として必要とされるメルカプト-トリアゾールの一般的定義を与える。この式において、R¹は好ましくはこの基に対して好適なものとして本発明による式(I)の物質の記載に関連して既に挙げられた意味を有する。

10

式(II)のメルカプト-トリアゾールのあるもののみが公知である。これらのものは式



(IV)

式中、R¹は上記のものである、
のトリアゾールを

20

順次希釈剤の存在下で強塩基及び硫黄と反応させ、次に適当ならば酸の存在下で水で加水分解するか、或いは

高沸点希釈剤の存在下で硫黄と反応させ、続いて適当ならば水及び適当ならば酸で処理するかいずれかにより製造し得る。

式(IV)は式(II)のメルカプト-トリアゾールを製造するための方法を行うために出発物質として必要とされるトリアゾールの一般的定義を与える。この式において、R¹は好ましくはこの基に対して好適なものとして本発明による式(I)の化合物の記載に関連して既に挙げられた意味を有する。

式(IV)のトリアゾールは公知であるか、または公知の方法により製造し得る(ヨーロッパ特許出願公開第0,015,756号、同第0,040,345号、同第0,052,424号、同第0,061,835号、同第0,297,345号、同第0,094,564号、同第0,196,038号、同第0,267,778号、同第0,378,953号、同第0,044,605号、同第0,069,442号、同第0,055,833号、同第0,301,393号、ドイツ国特許出願公開第2,324,010号、同第2,737,489号、同第2,551,560号、ヨーロッパ特許出願公開第0,065,485号、ドイツ国特許出願公開第2,735,872号、ヨーロッパ特許出願公開第0,234,242号、ドイツ国特許出願公開第2,201,063号、ヨーロッパ特許出願公開第0,145,294号及びドイツ国特許出願公開第3,721,786号参照)。

30

式(II)のメルカプトトリアゾールを製造するための上の工程()を行うために適する塩基はかかる反応に通常である全ての強アルカリ金属塩基である。好ましくはn-ブチルリチウム、リチウムジプロピル-アミド、水素化ナトリウム、ナトリウムアミドまたは他にテトラメチレンエチレン-ジアミン(=TMEDA)との混合物におけるカリウムt-ブチラートを用いる。

40

式(II)のメルカプト-トリアゾールを製造するための上の工程()を行うために適する希釈剤はかかる反応に通常である全ての不活性有機溶媒である。好ましくはエーテル例えばテトラヒドロフラン、ジオキサン、ジエチルエーテル及び1,2-ジメトキシエタン、更に液体アンモニア或いは他の強い極性溶媒例えばジメチルスルホキシドを用いる。上の工程()及び工程()の両方を行う場合、硫黄を好ましくは粉末の状態を用いる。

50

上の工程()を行う場合、水を適当ならば酸の存在下で加水分解のために用いる。適当な酸はかかる反応に通常である全ての無機または有機酸である。好ましくは酢酸、希硫酸及び希塩酸を用いる。しかしながらまた、塩化アンモニウム水溶液を用いて加水分解を行うこともできる。

上の工程()を行う場合、反応温度はある範囲内で変え得る。一般に、反応は - 70 乃至 20 間、好ましくは - 70 乃至 0 間の温度で行う。

上の工程()及び()は一般に大気圧下で行う。しかしながらまた、本法を昇圧または減圧下で行うこともできる。かくて、殊に工程()を行う場合、昇圧下での操作が可能である。

上の工程()を行う場合、式(IV)のトリアゾール1モル当たり一般に2~3当量、好ましくは2.0~2.5当量の強塩基及び続いて等価量または他には過剰の硫黄を用いる。反応は保護ガスの雰囲気下、例えば窒素またはアルゴン下で行い得る。処理は常法により行う。一般に、反応混合物を水にわずかしか溶解しない有機溶媒を用いて抽出し、一緒にした有機相を乾燥し、濃縮し、そして残った残渣を必要に応じて再結晶及び/またはクロマトグラフィーにより精製する。

10

上の工程()を行うために適する溶媒はかかる反応に通常である全ての高沸点有機溶媒である。好ましくはアミド例えばジメチルホルムアミド及びジメチルアセトアミド、更に複素環式化合物例えばN-メチル-ピロリドン、並びにまたエーテル例えばジフェニルエーテルを用いる。

上の工程()を行う場合、適当ならば水及び適当ならば酸を用いる処理を反応に続いて行い得る。これは工程()を行う場合の加水分解と同様に行う。

20

上の工程()を行う場合、反応温度はまた比較的広い範囲内で変え得る。一般に、反応は150乃至300間、好ましくは180乃至250間の温度で行う。

上の工程()を行う場合、一般に式(IV)のトリアゾール1モル当たり1~5モル、好ましくは1.5~3モルの硫黄を用いる。処理は常法により行う。一般に、反応混合物を水にわずかしか溶解しない有機溶媒を用いて抽出し、一緒にした有機相を乾燥し、濃縮し、そして残った残渣を適当ならば通常の方法例えば再結晶またはクロマトグラフィーを用いて存在し得るいずれの不純物も除去する。

本発明による工程を行う場合、式(III)のクロロシアンは反応成分として作用する。新たに調製したものをを用いることが有利である。この目的のために、シアン化水素酸の塩例えばシアン化カリウムを酸例えば酢酸の存在下で塩素ガスで処理することによりその場で調製することが好ましい。

30

本発明による工程を行うために適する希釈剤はかかる反応に通常である全ての溶媒である。好ましくは有機酸例えば酢酸を用いる。

本発明による工程を行う場合、反応温度はある範囲内で変え得る。一般に、本法は0乃至60間、好ましくは10乃至40間の温度で行う。

本発明による工程は一般に大気圧下で行う。しかしながらまた、減圧下で行うこともできる。

本発明による工程を行う場合、式(II)のメルカプト-トリアゾール1モル当たり一般に1~3モルの式(III)のクロロシアンを用いる。クロロシアンは一般にシアン化水素酸のアルカリ金属塩例えばシアン化ナトリウムまたはシアン化カリウムを有機酸例えば酢酸の存在下で塩素ガスで処理することによりその場で発生させることが好ましい。処理は常法により行う。一般に、反応が終了した後、反応混合物をわずかしか水と混和しない有機溶媒で希釈し、混合物をアルカリ水溶液で繰り返し抽出し、次に有機相を乾燥し、次に減圧下で濃縮する。生じる生成物から適当ならば常法例えば再結晶またはクロマトグラフィーを用いてまだ存在し得るいずれの不純物も除去し得る。

40

本発明による工程により得られる式(I)のチオシアナト-トリアゾリル誘導体は酸付加塩または金属塩錯体に転化し得る。

式(I)の化合物の酸付加塩の調製に適する酸は好ましくは好適な酸として本発明による酸付加塩の記載に関連して既に挙げられたものである。

50

式(I)の化合物の酸付加塩は通常の塩生成法により、例えば式(I)の化合物を適当な不活性溶媒に溶解し、酸例えば塩酸を加えることにより簡単に得ることができ、そしてこれらのものは公知の方法で、例えば濾別により単離し、そして適当ならば不活性有機溶媒で洗浄することにより精製することができる。

式(I)の化合物の金属塩錯体の製造に適する塩は好ましくは好適な金属塩として本発明による金属塩錯体の記載に関連して既に挙げられた金属のものである。

式(I)の化合物の金属塩錯体は常法により簡単に、例えば金属塩をアルコール例えばエタノールに溶解し、そしてこの溶液を式(I)の化合物に加えることにより得ることができる。金属塩錯体は公知の方法で、例えば濾別により単離し、そして適当ならば再結晶により精製することができる。

本発明による活性化化合物は強い殺微生物活性(microbicidal activity)を有し、そして作物保護及び材料の保護において望ましくない微生物例えば菌・カビ(fungi)及びバクテリアを防除するために用いることができる。

作物保護において、殺菌・殺カビ剤(fungicides)はプラスモジオフォロミセテス(Plasmodiophoromycetes)、卵菌類(Oomycetes)、チトリジオミセテス(Chytridiomycetes)、接合菌類(Zygomycetes)、嚢子菌類(Ascomycetes)、担子菌類(Basidiomycetes)及び不完全菌類(Deuteromycetes)を防除するために用いる。

上記の主な属名に含まれる菌・カビ及びバクテリア病のある原因生物を非限定例として下に挙げる：

キサントモナス(Xanthomonas)種例えば白葉枯病(Xanthomonas oryzae)；

プソイドモナス(Pseudomonas)種例えばプソイドモナス・ラクリマンズ(Pseudomonas lachrymans)；

エルウイニア(Erwinia)種例えばエルウイニア・アミロボラ(Erwinia amylovora)；

ピチウム(Pythium)種例えば苗立枯病(Pythium ultimum)；

フィトフトラ(Phytophthora)種例えば疫病(Phytophthora infestans)；

プソイドペロノスポラ(Pseudoperonospora)種例えばべと病(Pseudoperonospora humuli または Pseudoperonospora cubensis)；

プラスモパラ(Plasmopara)種例えばべと病(Plasmopara viticola)；

ペロノスポラ(Peronospora)種例えばべと病(Peronospora pisi または P. brassicae)；

エリシフェ(Erysiphe)種例えばうどんこ病(Erysiphe graminis)；

スフェロテカ(Sphaerotheca)種例えばうどんこ病(Sphaerotheca fuliginea)；

ポドスフェラ(Podosphaera)種例えばうどんこ病(Podosphaera leucotricha)；

ベンチュリア(Venturia)種例えば黒星病(Venturia inaequalis)；

ピレノフォラ(Pyrenophora)種例えば網斑病(Pyrenophora teres または P. graminea) (分生胞子器状： Drechslera、同義： Helminthosporium)；

コクリオボルス(Cochliobolus)種例えば斑点病(Cochliobolus sativus)； (分生胞子器状： Drechslera、同義： Helminthosporium)；

ウロマイセス(Uromyces)種例えばさび病(Uromyces appendiculatus)；

プシニア(Puccinia)種例えば赤さび病(Puccinia recondita)；

ティレティア(Tilletia)種例えば網なまぐさ黒穂病(Tilletia caries)；

ウスティラゴ(Ustilago)種例えば裸黒穂病(Ustilago nuda または Ustilago avenae)；

ペリキュラリア(Pellicularia)種例えば紋枯病(Pellicularia sasakii)；

ピリキュラリア(Pyricularia)種例えばいもち病(Pyricularia oryzae)；

フーザリウム(Fusarium)種例えばフーザリウム・クルモルム(Fusarium culmorum)；

ボツリティス(Botrytis)種例えば灰色かび病(Botrytis cinerea)；

セプトリア(Septoria)種例えばふ枯病(Septoria nodorum)；

レプトスフェリア(Leptosphaeria)種例えばレプトスフェリア・ノドルム(Leptosphaeria nodorum)；

10

20

30

40

50

セルコスボラ (*Cercospora*) 種例えばセルコスボラ・カネセンス (*Cercospora canescens*) ;

アルテルナリア (*Alternaria*) 種例えば黒斑病 (*Alternaria brassicae*) 及び
 プソイドセルコスボレラ (*Pseudocercospora*) 種例えばプソイドセルコスボレラ・ヘルポトリコイデス (*Pseudocercospora herpotrichoides*) 。

植物の病気を防除する際に必要な濃度で、本活性化化合物の植物による良好な許容性があるために、植物の地上部分、生長増殖茎及び種子、並びに土壌の処理が可能である。

本発明による活性化化合物はイネにおけるいもち病 (*Pyricularia oryzae*) 及び紋枯病 (*Pellicularia sasakii*) を防除し、そして穀物病例えばプソイドペロノスポラ (*Pseudoperonospora*) 種、エリシフェ (*Erysiphe*) 種及びフーザリウム (*Fusarium*) 種を防除するために殊に適する。更に、本発明による物質はベンチュリア (*Venturia*) 種及びスフェロテカ (*Sphaerotheca*) 種に対して極めて有用である。加えて、これらのものはまた極めて良好な試験管内活性を有する。

10

材料の保護において、本発明の物質は望ましくない微生物による攻撃及び破壊から工業用材料を保護するために使用し得る。

これに関連して工業用材料とは工業に使用するために製造された非生命の材料を表す。例えば、微生物的な変化または破壊に対して新規な活性化化合物により保護される工業用材料は接着剤、糊、紙及び板紙、織物、皮革、木材、コーティング組成物及びプラスチック製品、冷却用潤滑剤並びに微生物に感染されるか、または分解され得る他の材料であり得る。保護される材料に関して、微生物の増殖により悪影響を受け得る製造プラントの部分例えば冷却水循環系をまた挙げ得る。本発明に関連して、好適に挙げ得る工業用材料は接着剤、糊、紙及び板紙、皮革、木材、コーティング組成物、冷却用潤滑剤並びに熱移動用液体、特に木材である。

20

工業用材料を破壊または変化させ得る微生物の例にはバクテリア、菌・カビ、酵母、藻類及び粘菌微生物がある。本発明による活性物質は好ましくは菌・カビ、特に糸状菌 (*mould fungi*)、木材変色性及び木材破壊性菌・カビ (*Basidiomycetes*) 並びにまた粘菌微生物及び藻類に対して作用する。

例えば、次の属の微生物を挙げ得る：

不完全真菌属 (*Alternaria*) 例えばアルテルナリア・テヌイス (*Alternaria tenuis*)、
 アスペルギルス属 (*Aspergillus*) 例えば黒色こうじ菌クロカビ (*Aspergillus niger*)、
 ケトミウム属 (*Chaetomium*) 例えばケトミウム・グロボスム (*Chaetomium globosum*)、
 コニオフォラ属 (*Coniophora*) 例えばコニオフォラ・プエタナ (*Coniophora puetana*)、
 レンチヌス属 (*Lentinus*) 例えばレンチヌス・チグリヌス (*Lentinus tigrinus*)、
 ペニシリウム属 (*Penicillium*) 例えばペニシリウム・グラウクム (*Penicillium glaucum*)、

30

ポリポルス属 (*Polyporus*) 例えばポリポルス・ベルシコロル (*Polyporus versicolor*)

、
 アウレオバシジウム属 (*Aureobasidium*) 例えばアウレオバシジウム・プルランス (*Aureobasidium pullulans*)、

スクレロフォーマ属 (*Sclerophoma*) 例えばスクレロフォーマ・ピチオフィラ (*Sclerophoma pityophila*)、

40

トリコデルマ属 (*Trichoderma*) 例えばトリコデルマ・ビリデ (*Trichoderma viride*)、

エシェリヒア属 (*Escherichia*) 例えば大腸菌 (*Escherichia coli*)、

プソイドモナス属 (*Pseudomonas*) 例えば緑濃菌 (*Pseudomonas aeruginosa*)、

葡萄球菌属 (*Staphylococcus*) 例えば黄色葡萄球菌 (*Staphylococcus aureus*) 。

そのそれぞれの物理的及び/または化学的特性に依存して、本活性物質は普通の組成物例えば、溶液、乳液、懸濁剤、粉末、包沫剤、塗布剤、顆粒、エアロゾル、種子用の重合物質中の極く細かいカプセル及びコーティング組成物、並びにULV冷及び温ミスト調製物に変えることができる。

これらの組成物は公知の方法において、例えば活性化化合物を伸展剤、即ち液体溶媒、圧力

50

下での液化ガス及び/または固体の担体と随時表面活性剤、即ち乳化剤及び/または分散剤及び/または発泡剤と混合して製造される。また伸展剤として水を用いる場合、例えば補助溶媒として有機溶媒を用いることもできる。液体溶媒として、主に、芳香族炭化水素例えばキシレン、トルエンもしくはアルキルナフタレン、塩素化された芳香族もしくは塩素化された脂肪族炭化水素例えばクロロベンゼン、クロロエチレンもしくは塩化メチレン、脂肪族炭化水素例えばシクロヘキサン、またはパラフィン例えば鉱油留分、アルコール例えばブタノールもしくはグリコール並びにそのエーテル及びエステル、ケトン例えばアセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトンもしくはシクロヘキサノン、強い有極性溶媒例えばジメチルホルムアミド及びジメチルスルホキシド並びに水またが適している；液化した気体の伸展剤または担体とは、常温及び常圧では気体である液体を意味し、例えばハロゲン化された炭化水素並びにブタン、プロパン、窒素及び二酸化炭素の如きエアロゾル噴射基剤である；固体の担体として、粉碎した天然鉱物、例えばカオリン、クレイ、タルク、チョーク、石英、アタパルジャイト、モントモリロナイト、またはケイソウ土並びに粉碎した合成鉱物例えば高度分散性シリカ、アルミナ及びシリケートが適している；粒剤に対する固体の担体として、粉碎し且つ分別した天然岩、例えば方解石、大理石、軽石、海泡石及び白雲石並びに無機及び有機のひきわり合成顆粒及び有機物質の顆粒例えばおがくず、やしがら、トウモロコシ穂軸及びタバコ茎が適している；乳化剤及び/または発泡剤として非イオン性及び陰イオン性乳化剤例えばポリオキシエチレン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレン脂肪族アルコールエーテル例えばアルキルアリアルポリグリコールエーテル、アルキルスルホネート、アルキルスルフェート、アリアルスルホネート並びにタンパク質水解物が適している；分散剤として、例えばリグニン - スルファイト廃液及びメチルセルロースが適している。

10

粘着剤例えばカルボキシメチルセルロース並びに粉状、粒状またはラテックス状の天然及び合成重合体例えばアラビアゴム、ポリビニルアルコール及びポリビニルアセテート並びに天然リン脂質例えばセファリン及びレシチン、及び合成リン脂質を組成物に用いることができる。他の添加物は鉱油及び植物油であることができる。

20

着色剤例えば無機顔料、例えば酸化鉄、酸化チタン及びプルシアンブルー並びに有機染料例えばアリザリン染料、アゾ染料及び金属フタロシアニン染料、及び微量の栄養剤例えば鉄、マンガン、ホウ素、銅、コバルト、モリブデン及び亜鉛の塩を用いることができる。調製物は一般に活性化化合物 0.1 乃至 95 重量%間、好ましくは 0.5 乃至 90 重量%間からなる。

30

作物の保護に用いる場合、本発明による活性化化合物はその調製物中で、例えば作用のスペクトルを広げるか、または耐性の蓄積を防止するために公知の殺菌・殺カビ剤、殺バクテリア剤 (bactericides)、殺ダニ剤 (acaricides)、殺線虫剤 (nematicides) または殺虫剤との混合物として使用し得る。多くの場合、相乗効果が得られ、即ち混合物の活性は個々の成分の活性より高い。

混合物に対して適当である成分は例えば次の物質である：

殺菌・殺カビ剤：

2 - アミノブタン； 2 - アニリノ - 4 - メチル - 6 - シクロプロピル - ピリミジン； 2, 6 - ジブromo - 2 - メチル - 4 - トリフルオロメトキシ - 4 - トリフルオロ - メチル - 1, 3 - チアゾール - 5 - カルボキシアニリド； 2, 6 - ジクロロ - N - (4 - トリフルオロメチルベンジル) - ベンズアミド； (E) - 2 - メトキシイミノ - N - メチル - 2 - (2 - フェノキシフェニル) - アセトアミド； 硫酸 8 - ヒドロキシキノリン； (E) - 2 - { 2 - [6 - (2 - シアノフェノキシ) - ピリミジン - 4 - イルオキシ] フェニル } - 3 - メトキシアクリル酸メチル； (E) - メトキシイミノ [アルファ - (o - トリルオキシ) - o - トリル] 酢酸メチル； 2 - フェニルフェノール (OPP)、アルジモルフ、アムプロピルフォス、アニラジン、アザコナゾール、ベナラキシル、ベノダニル、ベノミル、ピナバクリル、ピフェニル、ピテルタノール、プラスチックジン - S、プロムコナゾール、ブピリメート、ブチオベート、カルシウムポリスルフィド、カプタフォル、カプタン、カルベンダジム、カルボキシシ、

40

50

キノメチオネート、クロロネブ、クロロピクリン、クロロタロニル、クロゾリネート、ク
フラネブ、シモキサニル、シプロコナゾール、シプロフラム、

ジクロロフェン、ジクロブトラゾール、ジクロフルアニド、ジクロメジン、ジクロラン、
ジエトフェンカルブ、ジフェノコナゾール、ジメチリモル、ジメトモルフ、ジニコナゾー
ル、ジノカップ、ジフェニルアミン、ジピリチオン、ジタリムフォス、ジチアノン、ドジ
ン、ドラゾキシロン、

エディフェンフォス、エボキシコナゾール、エチリモル、エトリジアゾール、
フェナリモル、フェンブコナゾール、フェンフラム、フェニトロパン、フェンピクロニル
、フェンプロピジン、フェンプロピモルフ、酢酸フェンチン、フェンチンヒドロキシド、
フェルバム、フェリムゾン、フルアジナム、フルジオキシニル、フルオロミド、フルキン
コナゾール、フルシラゾール、フルスルファミド、フルトラニル、フルトリアフォル、フ
オルベット、フォセチル - アルミニウム、フタリド、フベリダゾール、フララキシル、フ
ルメシクロックス、

グアザチン、

ヘキサクロロベンゼン、ヘキサコナゾール、ヒメキサゾール、

イマザリル、イミベンコナゾール、イミノクタジン、イプロベンフォス (I B P)、イプ
ロジオン、イソプロチオラン、カスガマイシン、銅調製物例えば水酸化銅、ナフテン酸銅
、オキシ塩化銅、硫酸銅、酸化銅、オキシニル - 銅及びボルドー混合物、マンカップー、マ
ンコゼブ、マネブ、メパニピリム、メプロニル、メタラキシル、メトコナゾール、メタス
ルホカルブ、メトフロキサム、メチラム、メトスルホバックス、マイクロブタニル、
ニッケルジメチルジチオカルバメート、ニトロタル - イソプロピル、ヌアリモル、
オフレース、オキサジキシル、オキサモカルブ、オキシカルボキシニル、

ペフラゾエート、ペンコナゾール、ペンシクロン、フォスジフェン、ピマリシン、ピペラ
リン、ポリオキシニル、プロベナゾール、プロクロラズ、プロシミドン、プロパモカルブ、
プロピコナゾール、プロピネブ、ピラゾフォス、ピリフェノックス、ピリメタニル、ピロ
キロン、

キントゼン (P C N B)、

硫黄及び硫黄調製物、

テブコナゾール、テクロフタラム、テクナゼン、テトラコナゾール、チアベンダゾール、
チシオフエン、チオファネート - メチル、チラム、トルクロフォス - メチル、トリルフル
アニド、トリアジメフォン、トリアジメノール、トリアゾキシド、トリクラミド、トリシ
クラゾール、トリデモルフ、トリフルミゾール、トリホリン、トリチコナゾール、バリダ
マイシン A、ピンクロゾリン、

ジネブ、ジラム。

殺バクテリア剤：

プロノボル、ジクロロフェン、ニトラピリン、ニッケルジメチルジチオカルバメート、カ
スガマイシン、オクチリノン、フランカルボン酸、オキシテトラサイクリン、プロベナゾ
ール、ストレプトマイシン、テクロフタラム、硫酸銅及び他の銅調製物。

殺虫剤 / 殺ダニ剤 / 殺線虫剤：

アバメクチン、A C 3 0 3 6 3 0、アセフェート、アクリナトリン、アラニカルブ、
アルジカルブ、アルファメトリン、アミトラズ、アベルメクチン、A Z 6 0 5 4 1、ア
ザジラクチン、アジンフォス A、アジンフォス M、アザサイクロチン、バシルス・ツリン
ジエンシス (Bacillus thuringiensis)、ベンジオカルブ、ベンフラカルブ、ベンスルタ
ップ、ベタシルトリン、ピフェントリン、B P M C、プロフェンブロックス、プロモフォ
ス A、プフェンカルブ、ププロフェジン、プトカルボキシニル、プチルピリダベン、

カズサフォス、カルバリル、カルボフラン、カルボフェノチオン、カルボスルファン、カ
ータップ、C G A 1 5 7 4 1 9、C G A 1 8 4 6 9 9、クロエトカルブ、クロエ
トキシフォス、クロールフェンピンフォス、クロールフルアズロン、クロールメフォス、クロー
ルピリフォス、クロールピリフォス M、シス - レスメトリン、クロシトリン、クロフェンテジ
ン、シアノフォス、シクロプロトリン、シフルトリン、シハロトリン、シヘキサチン、シ

10

20

30

40

50

ペルメトリン、シロマジン、デルタメトリン、デメトンM、デメトンS、デメトン-S-メチル、ジアフェンチウロン、ジアジノン、ジクロフェンチオン、ジクロルボス、ジクリフォス、ジクロトフォス、ジエチオン、ジフルベンズロン、ジメトエート、ジメチルピンフォス、ジオキサチオン、ジスルホトン、

エジフェンフォス、エマメクチン、エスフェンバレレート、エチオフェンカルブ、エチオン、エトフェンプロックス、エトプロフォス、エトリムフォス、

フェナミフォス、フェナザキン、フェンブタチンオキシド、フェニトロチオン、フェノブカルブ、フェノチオカルブ、フェノキシカルブ、フェンプロパトリン、フェンピラド、フェンピロキシメート、フェンチオン、フェンチオン、フェンバレレート、フィプロニル、フルアジナム、フルシクロクスロン、フルシトリネート、フルフェノクスロン、フルフェンプロクス、フルバリネート、フォノフォス、フォルモチオン、フォスチアゼート、フブフェンプロクス、フラチオカルブ、

HCH、ヘプテノフォス、ヘキサフルムロン、ヘキシチアゾックス、

イミダクロプリド、イプロベンフォス、イサゾフォス、イソフェンフォス、イソプロカルブ、イソキサチオン、イベルメクチン、ラムダ-シハロトリン、ルフェヌロン、

マラチオン、メカルバム、メルピンフォス、メスルフェンフォス、メタアルデヒド、メタアクリフォス、メタアミドフォス、メチダチオン、メチオカルブ、メトミル、メトルカルブ、ミルベメクチン、モノクロトフォス、モキシデクチン、

ナレド、NC 184、NI 25、ニテンピラム、

オメトエート、オキサミル、オキシデメトンM、オキシデプロフォス、

パラチオンA、パラチオンM、パーメトリン、フェントエート、フォレート、フォサロン、フォスメット、フォスファミロン、フォキシム、ピリミカルブ、ピリミフォスM、ピリミフォスA、プロフェノフォス、プロメカルブ、プロパフォス、プロボクスル、プロチオフォス、プロチオホス、プロトエート、ピメトロジン、ピラクロフォス、ピラダフェンチオン、ピレスメトリン、ピレトラム、ピリダベン、ピリミジフェン、ピリプロキシフェン、キナルフォス、

RH 5992、

サリチオン、セブフォス、シラフルオフェン、スルフォテップ、スルプロフォス、

テブフェノジド、テブフェンピラド、テブピリムフォス、テフルベンズロン、テフルトリン、テメフォス、テルバム、テルブフォス、テトラクロルピンフォス、チアフェノックス、チオジカルブ、チオファノックス、チオメトン、チオナジン、ツリンジエンシン、トラロメトリン、トリアラテン、トリアゾフォス、トリアズロン、トリクロルフォン、トリフルムロン、トリメタカルブ、

バミドチオン、XMC、キシリルカルブ、ゼータメトリン。

他の公知の活性化化合物例えば除草剤または肥料及び生長調節剤との混合物も可能である。本活性化化合物はそのまま、その調製物の形態或いは該調製物から調製した使用形態、例えば調製液剤、乳化可能濃厚剤、乳剤、発泡剤、懸濁剤、水和剤、塗布剤、可溶性粉剤、粉剤及び粒剤の形態で使用することができる。これらのものは普通の方法において、例えば液剤散布(watering)、スプレー、アトマイジング、粒剤散布(scattering)、粉剤散布(dusting)、フォーミング(foaming)、はけ塗り等によって施用される。更に、超低容量法に従って活性化化合物を施用するか、或いは活性化化合物の調製物または活性化化合物自体を土壤中に注入することができる。また植物の種子を処理することもできる。

植物の部分を処理する際に、施用形態における活性物質の濃度は比較的広い範囲内で変えることができ：一般に濃度は1乃至0.0001重量%間、好ましくは0.5乃至0.001重量%間である。

種子を処理する際には、一般に種子1kg当り0.001~50g、好ましくは0.01~10gの量の活性物質を必要とする。

土壌を処理する場合には、作用場所に0.00001~0.1重量%、好ましくは0.0001~0.02重量%の活性物質濃度を必要とする。

工業用材料の保護に用いられる組成物は一般に1~95%、好ましくは10~75%の量

10

20

30

40

50

の活性物質からなる。

新規な活性物質を施用する濃度は防除する微生物の特性及び頻度並びに保護される材料の組成に依存する。用いられる最適量は一連の試験により決め得る。一般に、施用濃度は保護される材料をベースとして0.001～5重量%、好ましくは0.05～1.0重量%の範囲である。

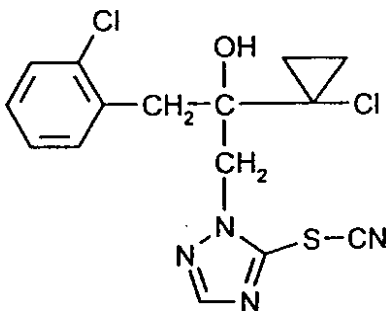
本発明による材料保護に用いられる活性物質またはこれらのものから調製され得る組成物、濃厚剤もしくは極めて一般的には調製物の効果及び作用のスペクトルは作用のスペクトルを増大させるか、または特殊な効果例えば昆虫に対する追加の保護を達成させるために更に抗微生物的に活性な化合物、殺菌・殺カビ剤、殺バクテリア剤、除草剤、殺虫剤または他の活性物質を必要に応じて加えることにより増大させ得る。これらの混合物は本発明

10

による化合物より広い作用のスペクトルを持ち得る。

製造実施例

実施例 1



(I-1)

20

20 で、塩素ガスを酢酸20ml中の2-(1-クロロ-シクロプロピル)-1-(2-クロロ-フェニル)-3-(5-メルカプト-1,2,4-トリアゾル-1-イル)-プロパン-2-オール1.72g(5ミリモル)及びシアン化カリウム0.65g(10ミリモル)の混合物中に導入した。反応混合物を20 で20時間攪拌し、次にジクロロメタンで希釈した。次に混合物を希釈水酸化ナトリウム水溶液で繰り返し抽出し、有機相を硫酸ナトリウム上で乾燥し、そして減圧下で濃縮した。残った生成物を移動相として石油エーテル/酢酸エチル=1:1を用いてシリカゲル上で精製した。溶離液の濃縮により2-(1-クロロ-シクロプロピル)-1-(2-クロロ-フェニル)-3-(5-チオシアン

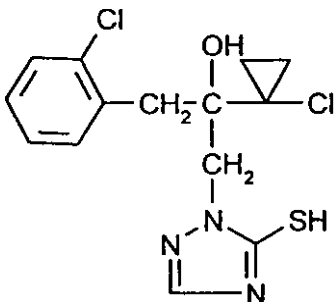
30

1H-NMRスペクトル(400MHz; CDCl₃; TMS):

= 0.5 - 0.7 (m, 4H); 3.2 (d, 1H); 3.6 (d, 1H); 3.65 (OH); 4.2 (d, 1H); 4.95 (d, 1H); 7.2 - 7.55 (m, 4H); 8.1 (s, 1H) ppm。

出発物質の製造:

実施例 2



(II-1)

40

変法 :

- 20 で、2-(1-クロロ-シクロプロピル)-1-(2-クロロフェニル)-3-(1,2,4-トリアゾル-1-イル)-プロパン-2-オール3.12g(10ミリモル)及び無水テトラヒドロフラン45mlの混合物をヘキサン中のn-ブチルリチウム8

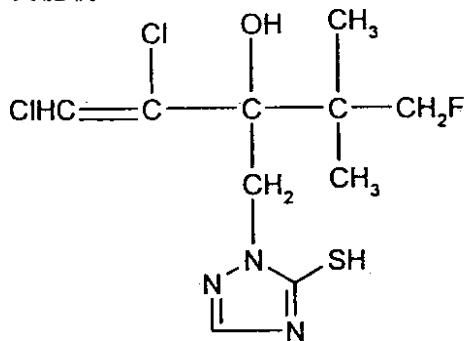
50

． 4 m l (2 1 ミリモル) と混合し、そして混合物を 0 で 3 0 分間攪拌した。次に反応混合物を - 7 0 に冷却し、硫黄粉末 0 . 3 2 g (1 0 ミリモル) と混合し、そして - 7 0 で 3 0 分間攪拌した。混合物を - 1 0 に加温し、氷 - 水と混合し、そして希硫酸の添加により p H 5 に調整した。混合物を酢酸エチルで繰り返し抽出し、一緒にした有機相を硫酸ナトリウム上で乾燥し、そして減圧下で濃縮した。このようにして、 2 - (1 - クロロ - シクロプロピル) - 1 - (2 - クロロフェニル) - 3 - (5 - メルカプト - 1 , 2 , 4 - トリアゾル - 1 - イル) - プロパン - 2 - オール 3 . 2 g (理論値の 9 3 %) が再結晶後に 1 3 8 ~ 1 3 9 で溶融する固体物質の状態を得られた。

変法

2 - (1 - クロロ - シクロプロピル) - 1 - (2 - クロロ - フェニル) - 3 - (1 , 2 , 4 - トリアゾル - 1 - イル) - プロパン - 2 - オール 3 . 1 2 g (1 0 ミリモル)、硫黄粉末 0 . 9 6 g (3 0 ミリモル) 及び無水 N - メチル - ピロリドン 2 0 m l の混合物を 2 0 0 で攪拌しながら 4 4 時間加熱した。続いて反応混合物を減圧下 (0 . 2 ミリバール) で濃縮した。生じた粗製生成物 (3 . 1 g) をトルエンから再結晶した。このようにして、 2 - (1 - クロロ - シクロプロピル) - 1 - (2 - クロロフェニル) - 3 - (5 - メルカプト - 1 , 2 , 4 - トリアゾル - 1 - イル) - プロパン - 2 - オール 0 . 7 g (理論値の 2 0 %) が融点 1 3 8 ~ 1 3 9 の固体物質の状態を得られた。

実施例 3

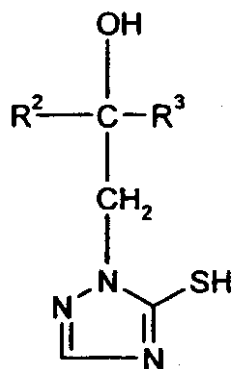


(II-2)

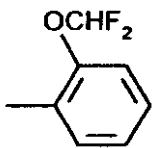
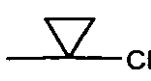

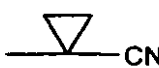
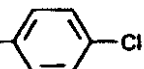
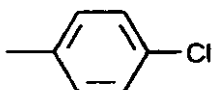
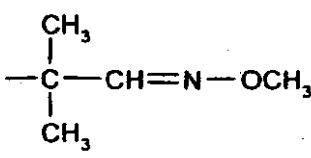
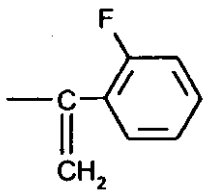
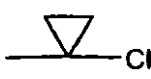
- 7 0 で、 1 , 2 - ジクロロ - 4 , 4 - ジメチル - 5 - フルオロ - 3 - ヒドロキシ - 3 - [(1 , 2 , 4 - トリアゾル - 1 - イル) - メチル] - 1 - ペンテン 1 . 4 1 g (5 ミリモル) 及び無水テトラヒドロフラン 2 5 m l の混合物をヘキサン中の n - ブチル - リチウム 4 m l (1 0 ミリモル) と混合し、そして混合物を - 7 0 で 1 時間攪拌した。次に反応混合物を硫黄粉末 0 . 1 9 g (6 ミリモル) と混合し、そして - 7 0 で 4 時間攪拌した。混合物を順次 - 7 0 でメタノール 1 m l 及び酢酸 1 m l を添加することにより加水分解した。反応混合物を最初に酢酸エチルで希釈し、次に飽和塩化アンモニウム水溶液で繰り返し抽出した。有機相を硫酸ナトリウム上で乾燥し、そして減圧下で濃縮した。生じた粗製生成物 (1 . 7 g) を移動相として石油エーテル及び酢酸エチルの混合物 = 1 : 1 を用いてシリカゲルクロマトグラフィーにより精製した。このようにして、 1 , 2 - ジクロロ - 4 , 4 - ジメチル - 5 - フルオロ - 3 - ヒドロキシ - 3 - [(5 - メルカプト - 1 , 2 , 4 - トリアゾル - 1 - イル) - メチル] - 1 - ペンテン 0 . 5 g (理論値の 3 2 %) が融点 1 6 2 ~ 1 6 4 の固体物質の状態を得られた。

下の表 1 2 に示す化合物を実施例 2 及び 3 に示される方法により製造した。

表 12



(II-b)

実施例 番号	化合物 番号	R ²	R ³	物理定数
4	(II-3)	—CCl=CHCl	—C(CH ₃) ₃	融点 168- 169°C
5	(II-4)			GC/MS (Cl):376 (M+H ⁺)
6	(II-5)			融点 163- 164°C
7	(II-6)	—CH ₂ —O— 	—C(CH ₃) ₃	融点 127°C
8	(II-7)			油
9	(II-8)			GC/MS (Cl):340 (M+H ⁺)

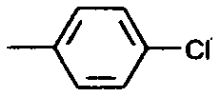
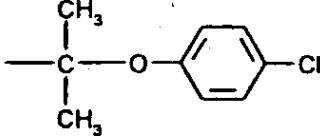
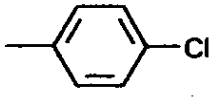

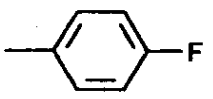

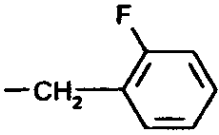
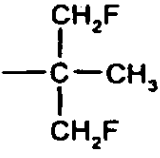
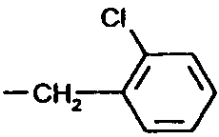

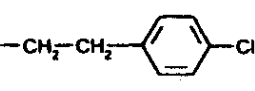
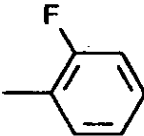
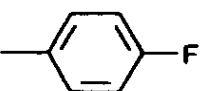
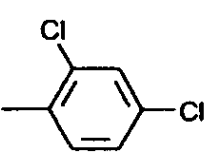
10

20

30

40

表 12 (続)

実施例 番号	化合物 番号	R ²	R ³	物理定数
10	(II-9)			GC/MS (Cl):424 (M+H ⁺)
11	(II-10)			融点 168°C
12	(II-11)			GC/MS (Cl):314 (M+H ⁺)
13	(II-12)			GC/MS (Cl):346 (M+H ⁺)
14	(II-13)			融点 115- 118°C
15	(II-14)		-C(CH ₃) ₃	GC/MS (Cl):340 (M+H ⁺)
16	(II-15)			GC/MS (Cl):334 (M+H ⁺)
17	(II-16)		-C ₄ H _{9-n}	*)

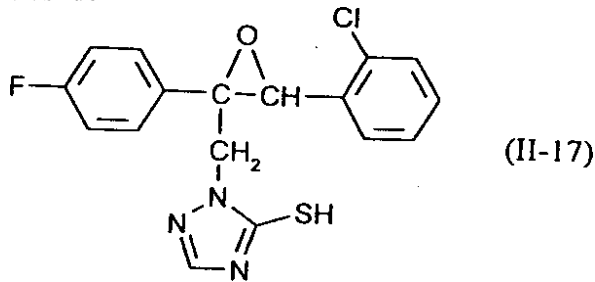
*) 化合物は¹H NMRスペクトル (400MHz, CDCl₃/TM

S) における次の信号により特性化した:

= 0.8 (t, 3H); 0.85 (m, 2H); 1.25 (m, 2H); 1.8 (m, 50

1 H) ; 2 . 5 5 (m , 1 H) ; 4 . 6 (O H) ; 4 . 9 (A B , 2 H) ; 7 . 2 (d d , 1 H) ; 7 . 3 5 (d , 1 H) ; 7 . 7 (s , 1 H) ; 7 . 7 5 (d , 1 H) ; 1 2 . 3 (5 H) p p m .

実施例 1 8



10

- 7 0 で、3 - (2 - クロロ - フェニル) - 2 - (4 - フルオロ - フェニル) - 2 - (1 , 2 , 4 - トリアゾル - 1 - イル - メチル) - オキシラン (Z 形) 1 . 3 g (4 ミリモル) 及び無水テトラヒドロフラン 2 5 m l の混合物をヘキサン中の n - ブチル - リチウム 2 . 0 m l (5 ミリモル) と混合し、そして混合物を - 7 0 で 1 時間攪拌した。次に反応混合物を硫黄粉末 0 . 1 6 g (5 ミリモル) と混合し、そして - 7 0 で 4 時間攪拌した。 - 7 0 で、メタノール 1 m l 及び酢酸 1 m l を順次攪拌しながら同時に滴加した。生じた混合物をジクロロメタンで希釈し、そして飽和塩化アンモニウム水溶液で繰り返し抽出した。有機相を硫酸ナトリウム上で乾燥し、次に減圧下で濃縮した。ガスクロマトグラフィーにより出発物質 2 0 . 7 % に加えて所望の生成物 5 1 . 0 % を含む生じた粗製生成物 (1 . 9 g) をトルエンから再結晶した。このようにして、3 - (2 - クロロフェニル) - 2 - (4 - フルオロ - フェニル) - 2 - (5 - メルカプト - 1 , 2 , 4 - トリアゾル - 1 - イル - メチル) - オキシラン (Z 形) 0 . 8 g (理論値の 5 5 %) が融点 1 7 9 ~ 1 8 0 の固体物質として得られた。

20

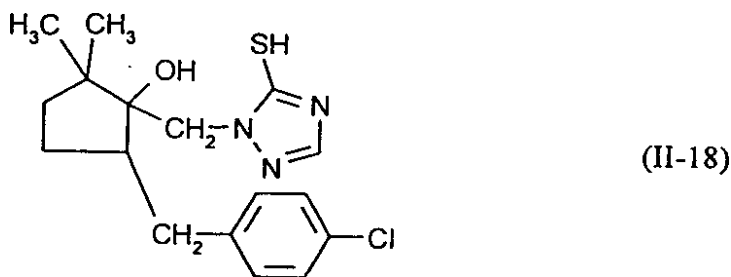
¹ H NMR スペクトル (2 0 0 M H z ; C D C l ₃ ; T M S) :

= 3 . 7 (d , J = 1 5 H z , 1 H) ; 4 . 1 (s , 1 H) ; 5 . 1 5 (d , J = 1 5 H z , 1 H) ; 6 . 9 5 - 7 . 6 (m , 8 H) ; 7 . 6 5 (s , 1 H) ; 1 1 . 0 (s , 1 H) p p m .

G C / M S (c i) : 3 6 2 (M + H ⁺)

30

実施例 1 9



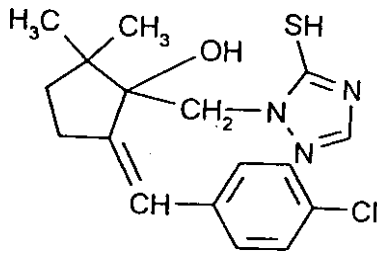
- 2 0 で、5 - (4 - クロロベンジル) - 2 , 2 - ジメチル - 1 - (1 , 2 , 4 - トリアゾル - 1 - イル - メチル) - シクロペンタン - 1 - オール (Z 形) 1 . 6 g (5 ミリモル) 及び無水テトラヒドロフラン 3 0 m l の混合物を n - ブチル - リチウム 4 m l (1 0 ミリモル) 及びヘキサンと混合し、そして混合物を 0 で更に 3 0 分間攪拌した。続いて反応混合物を - 7 0 に冷却し、攪拌しながら硫黄粉末 0 . 1 9 g (6 ミリモル) と混合し、次に - 7 0 で 1 時間及び続いて 0 で 2 時間攪拌した。生じた混合物を酢酸エチルで希釈し、そして飽和塩化アンモニウム水溶液で繰り返し抽出した。有機相を硫酸ナトリウム上で乾燥し、次に減圧下で濃縮した。生じた粗製生成物 (2 . 0 g) をトルエンから再結晶した。このようにして、5 - (4 - クロロ - ベンジル) - 2 , 2 - ジメチル - 1 - (5 - メルカプト - 1 , 2 , 4 - トリアゾル - 1 - イル - メチル) - シクロペンタン - 1 - オール (Z 形) 1 . 1 g (理論値の 6 3 %) が融点 1 7 9 ~ 1 8 0 の固体物質として得られた。

40

50

GC / MS (ci) : 352 (M + H⁺)

実施例 20



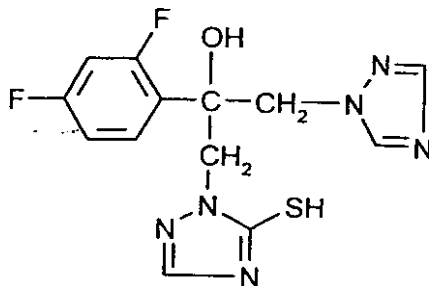
(II-19)

- 20 で、2 - (4 - クロロ - ベンジリデン) - 5, 5 - ジメチル - 1 - (1, 2, 4 - トリアゾル - 1 - イル - メチル) - シクロペンタン - 1 - オール 1.59 g (5 ミリモル) 及び無水テトラヒドロフラン 30 ml の混合物をヘキサン中の n - ブチル - リチウム 4.4 ml (11 ミリモル) と混合し、そして混合物を 0 で 30 分間攪拌した。続いて反応混合物を - 70 に冷却し、攪拌しながら硫黄粉末 0.19 g (6 ミリモル) と混合し、次に - 70 で 1 時間及び続いて 0 で 2 時間攪拌した。生じた混合物を酢酸エチルで希釈し、そして飽和塩化アンモニウム水溶液で繰り返し抽出した。有機相を硫酸ナトリウム上で乾燥し、次に減圧下で濃縮した。生じた粗製生成物 (1.9 g) を酢酸エチルを用いてシリカゲル上でクロマトグラフにかけた。このようにして、2 - (4 - クロロ - ベンジリデン) - 5, 5 - ジメチル - 1 - (5 - メルカプト - 1, 2, 4 - トリアゾル - 1 - イル - メチル) - シクロペンタン - 1 - オール 0.8 g (理論値の 46%) が得られた

¹H NMR スペクトル (200 MHz; CDCl₃; TMS) :

= 0.9 (s, 3H); 1.15 (s, 3H); 1.6 - 1.95 (m, 2H); 2.4 - 3.0 (m, 2H); 4.25 (d, 1H); 4.55 (d, 1H); 5.9 (m, 1H); 7.1 - 7.3 (m, 4H); 7.6 (s, 1H) ppm.

実施例 21

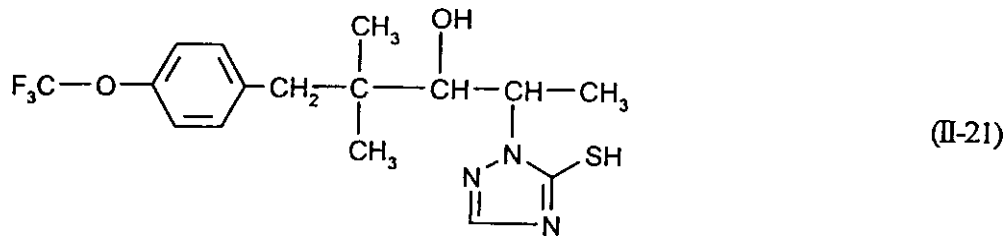


(II-20)

- 20 で、2 - (2, 4 - ジフルオロ - フェニル) - 1, 3 - ビス - (1, 2, 4 - トリアゾル - 1 - イル -) - プロパン - 2 - オール 1.53 g (5 ミリモル) 及び無水テトラヒドロフラン 30 ml の混合物をヘキサン中の n - ブチル - リチウム 4.4 ml (11 ミリモル) と混合し、そして混合物を 0 で 30 分間攪拌した。続いて反応混合物を - 70 に冷却し、攪拌しながら硫黄粉末 0.19 g (6 ミリモル) と混合し、次に - 70 で 1 時間及び続いて 0 で 2 時間攪拌した。生じた混合物を酢酸エチルで希釈し、そして飽和塩化アンモニウム水溶液で繰り返し抽出した。有機相を硫酸ナトリウム上で乾燥し、次に減圧下で濃縮した。生じた粗製生成物 (2.3 g) を移動相として酢酸エチル及びエタノール = 9 : 1 の混合物を用いてシリカゲルクロマトグラフィーにより精製した。このようにして、2 - (2, 4 - ジフルオロ - フェニル) - 1 - (5 - メルカプト - 1, 2, 4 - トリアゾル - 1 - イル -) - 3 - (1, 2, 4 - トリアゾル - 1 - イル) - プロパン - 2 - オール 1.0 g (理論値の 59%) が融点 187 の固体物質の状態を得られた。

GC / MS (ci) : 339 (M + H⁺)

実施例 22



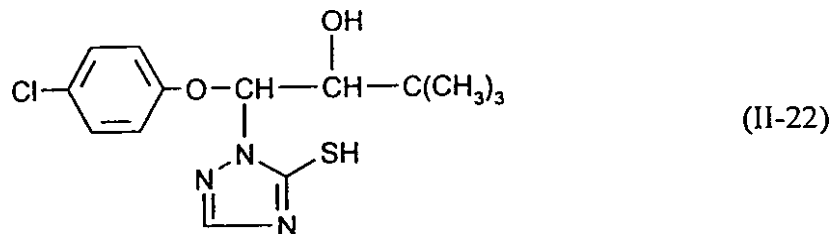
- 20 で、2,2-ジメチル-3-ヒドロキシ-4-(1,2,4-トリアゾル-1-イル)-1-(4-トリフルオロメトキシ-フェニル)-ペンタン1.72g(5ミリモル)及び無水テトラヒドロフラン30mlの混合物をヘキサン中のn-ブチル-リチウム4.4ml(1.1ミリモル)と混合し、そして混合物を0 で30分間攪拌した。続いて反応混合物を-70 に冷却し、攪拌しながら硫黄粉末0.19g(6ミリモル)と混合し、次に-70 で1時間及び続いて0 で2時間攪拌した。生じた混合物を酢酸エチルで希釈し、そして飽和塩化アンモニウム水溶液で繰り返し抽出した。有機相を硫酸ナトリウム上で乾燥し、次に減圧下で濃縮した。生じた粗製生成物(2.2g)を移動相として石油エーテル及び酢酸エチル=1:1の混合物を用いてシリカゲルクロマトグラフィーにより精製した。このようにして、2,2-ジメチル-3-ヒドロキシ-4-(5-メルカプト-1,2,4-トリアゾル-1-イル)-1-(4-トリフルオロメトキシ-フェニル)-ペンタン1.4g(理論値の75%)が融点125~126 の固体物質の状態を得られた。

10

GC/MS(c i): 376(M+H⁺)

20

実施例 2 3



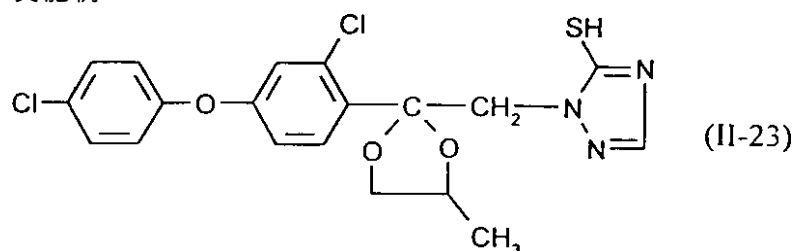
- 20 で、1-(4-クロロ-フェノキシ)-1-(1,2,4-トリアゾル-1-イル)-3,3-ジメチル-ブタン-2-オール1.48g(5ミリモル)及び無水テトラヒドロフラン30mlの混合物をヘキサン中のn-ブチル-リチウム4ml(1.0ミリモル)と混合し、そして混合物を-20 で30分間攪拌した。続いて反応混合物を-20 で攪拌しながら硫黄粉末0.19g(6ミリモル)と混合し、次に-20 で1時間及び続いて0 で2時間攪拌した。生じた混合物を酢酸エチルで希釈し、そして飽和塩化アンモニウム水溶液で繰り返し抽出した。有機相を硫酸ナトリウム上で乾燥し、次に減圧下で濃縮した。生じた粗製生成物(1.9g)を移動相として石油エーテル及び酢酸エチル=1:1の混合物を用いてシリカゲルクロマトグラフィーにより精製した。このようにして、1-(4-クロロフェノキシ)-1-(5-メルカプト-1,2,4-トリアゾル-1-イル)-3,3-ジメチル-ブタン-2-オール0.7g(理論値の43%)が融点193~194 の固体物質の状態を得られた。

30

MS(c i) = 328(M+H⁺)

40

実施例 2 4



2-[2-クロロ-4-(4-クロロ-フェノキシ)-フェニル]-2-(1,2,4-トリアゾル-1-イル-メチル)-4-メチル-1,3-ジオキソラン2.0g(5ミリ

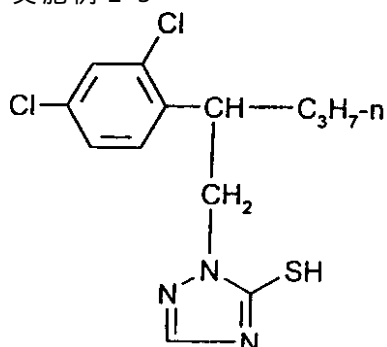
50

モル)、硫黄粉末 0.32 g (10 ミリモル) 及び無水 N - メチルピロリドン 10 ml の混合物を 200 で攪拌しながら 2 時間加熱した。続いて反応混合物を減圧下 (0.2 ミリバール) で濃縮した。残った残渣を酢酸エチルと混合し、そして生じた混合物を飽和塩化アンモニウム水溶液で繰り返し抽出した。有機相を硫酸ナトリウム上で乾燥し、次に減圧下で濃縮した。生じた粗製生成物 (1.8 g) を移動相として石油エーテル及び酢酸エチル = 1 : 1 の混合物を用いてシリカゲルクロマトグラフィーにより精製した。このようにして、2 - [2 - クロロ - 4 - (4 - クロロ - フェノキシ) - フェニル] - 2 - [(5 -メルカプト - 1, 2, 4 - トリアゾル - 1 - イル) - メチル] - 4 - メチル - 1, 3 - ジオキソラン 0.9 g (理論値の 41%) が異性体混合物の状態 で得られた。

MS (ci) : 438 (M + H⁺, 100%)

10

実施例 25

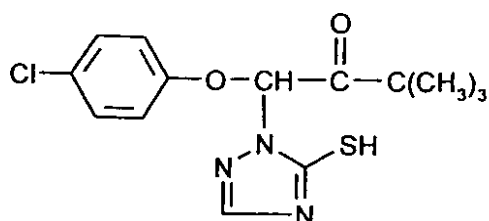


2 - (2, 4 - ジクロロ - フェニル) - 1 - (1, 2, 4 - トリアゾル - 1 - イル) - ペンタン 1.42 g (5 ミリモル)、硫黄粉末 0.32 g (10 ミリモル) 及び無水 N - メチルピロリドン 10 ml の混合物を 200 及び窒素雰囲気下で攪拌しながら 3 時間加熱した。続いて反応混合物を減圧下で濃縮した。残った残渣を酢酸エチルと混合し、そして生じた混合物を飽和塩化アンモニウム水溶液で繰り返し抽出した。有機相を硫酸ナトリウム上で乾燥し、次に減圧下で濃縮した。生じた粗製生成物 (2.1 g) を移動相として石油エーテル及び酢酸エチル = 1 : 1 の混合物を用いてシリカゲルクロマトグラフィーにより精製した。このようにして、2 - (2, 4 - ジクロロ - フェニル) - 1 - (5 -メルカプト - 1, 2, 4 - トリアゾル - 1 - イル) - ペンタン 1.5 g (理論値の 95%) が融点 103 の固体物質の状態 で得られた。

20

30

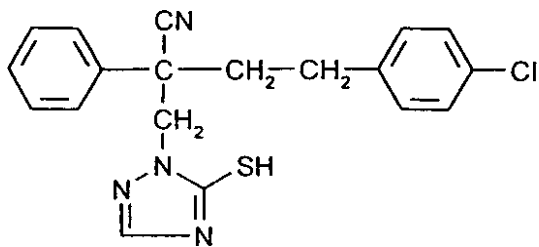
実施例 26



1 - (4 - クロロ - フェノキシ) - 1 - (1, 2, 4 - トリアゾル - 1 - イル) - 3, 3 - ジメチル - ブタン - 2 - オン 2.93 g (10 ミリモル)、硫黄粉末 0.64 g (20 ミリモル) 及び無水 N - メチルピロリドン 10 ml の混合物を 200 及び窒素雰囲気下で攪拌しながら 8 時間加熱した。続いて反応混合物を減圧下で濃縮し、そして残った残渣をジクロロメタンに溶解した。生じた混合物を飽和塩化アンモニウム水溶液で繰り返し抽出した。有機相を硫酸ナトリウム上で乾燥し、次に減圧下で濃縮した。生じた粗製生成物 (2.7 g) を移動相として石油エーテル及び酢酸エチル = 1 : 1 の混合物を用いてシリカゲルクロマトグラフィーにより精製した。このようにして、1 - (4 - クロロフェノキシ) - 1 - (5 -メルカプト - 1, 2, 4 - トリアゾル - 1 - イル) - 3, 3 - ジメチル - ブタン - 2 - オン 2.0 g (理論値の 62%) が融点 134 ~ 136 の固体物質の状態 で得られた。

40

実施例 27



(II-26)

4 - (4 - クロロ - フェニル) - 2 - シアノ - 2 - フェニル - 1 - (1 , 2 , 4 - トリアゾル - 1 - イル) - ブタン 1 . 6 8 g (5 ミリモル)、硫黄粉末 0 . 3 2 g (1 0 ミリモル) 及び無水 N - メチルピロリドン 1 0 m l の混合物を 2 0 0 及び窒素雰囲気下で撹拌しながら 4 7 時間加熱した。続いて反応混合物を減圧下で濃縮し、そして残った残渣を酢酸エチルに溶解した。生じた混合物を飽和塩化アンモニウム水溶液で繰り返し抽出した。有機相を硫酸ナトリウム上で乾燥し、次に減圧下で濃縮した。生じた粗製生成物 (1 . 9 g) を移動相として石油エーテル及び酢酸エチル = 1 : 1 の混合物を用いてシリカゲルクロマトグラフィーにより精製した。このようにして、4 - (4 - クロロ - フェニル) - 2 - シアノ - 2 - フェニル - 1 - (5 - メルカプト - 1 , 2 , 4 - トリアゾル - 1 - イル) - ブタン 0 . 7 g (理論値の 3 8 %) が油の状態で見られた。

^1H NMR スペクトル (4 0 0 M H z , C D C l ₃ , T M S) :

= 2 . 4 (m , 3 H) ; 2 . 7 5 (m , 1 H) ; 4 . 5 (A B , 2 H) ; 7 . 0 (d , 2 H) ; 7 . 2 (d , 2 H) ; 7 . 4 (m , 3 H) ; 7 . 5 5 (m , 2 H) ; 7 . 8 (s , 1 H) ; 1 1 . 7 (1 H) p p m .

使用例

実施例 A

ブソイドセルコスプレラ・ヘルボトリコイデス (*Pseudocercospora herpotrichoides*) 試験 ; W 株 (小麦) / 保護

溶 媒 : N - メチル - ピロリドン 1 . 0 重量部

乳化剤 : アルキルアールポリグリコールエーテル 0 . 6 重量部

活性化化合物の適当な調製物を製造するために、活性化化合物 1 重量部を上記量の溶媒及び乳化剤と混合し、そしてこの濃厚剤を水で希釈して所望の濃度にした。

保護活性を試験するために、若い植物に活性化化合物の調製物を上記施用割合で噴霧した。

噴霧コーティングが乾燥した後、この植物にブソイドセルコスプレラ・ヘルボトリコイデス (*Pseudocercospora herpotrichoides*) の W 株の胞子を茎の根元に接種した。

植物を約 1 0 の温度及び約 8 0 % の相対湿度の温床中に置いた。

評価を接種 2 1 日後に行った。0 % は対照の効能に対応するものを意味し、一方 1 0 0 % の効能は何ら感染が観察されないことを意味する。

活性化化合物、活性化化合物濃度及び試験結果を下の表に示す。

10

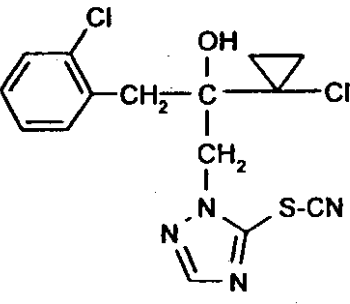
20

30

表 A

ブソイドセルコスボレラ・ヘルポトリコイデス試験；

W株（小麦）／保護

活性化化合物	活性化化合物の 施用割合、g/ha	効能、%
<p>本発明による</p>  <p>(I-1)</p>	250	100

実施例 B

いもち病（Pyricularia）試験（イネ）／保護

溶 媒：アセトン 12.5 重量部

乳化剤：アルキルアリールポリグリコールエーテル 0.3 重量部

活性化化合物の適当な調製物を製造するために、活性化化合物 1 重量部を上記量の溶媒と混合し、そしてこの濃厚剤を水で及び上記量の乳化剤で希釈して所望の濃度にした。

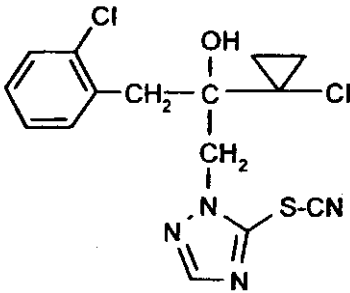
保護活性を試験するために、若いイネ植物に活性化化合物の調製物を滴り落ちる程度に濡れるまで噴霧した。噴霧コーティングが乾燥した 1 日後、植物にいもち病（Pyricularia oryzae）の水性孢子器懸濁液を接種した。続いて植物を相対湿度 100% 及び 25% で温床中に置いた。

評価を接種 4 日後に行った。0% は対照の効能に対応するものを意味し、一方 100% の効能は何ら感染が観察されないことを意味する。

活性化化合物、活性化化合物濃度及び試験結果を下の表に示す。

表 B

いもち病試験（イネ）／保護

活性化化合物	噴霧液中の活性化化合物の濃度、%	効能、%
<p data-bbox="231 716 391 750">本発明による</p> <div data-bbox="231 817 582 1108"><chem>Clc1ccccc1CC(O)(C1CC1)CC2=CN=CN2SC#N</chem></div> <p data-bbox="287 1265 351 1299">(I-1)</p>	0.05	90

10

20

30

フロントページの続き

(72)発明者 シュテンツエル, クラウス

ドイツ連邦共和国デー 4 0 5 9 5 デュツセルドルフ・ゼーゼナーシユトラーセ 1 7

(72)発明者 ヘンスラー, ゲルト

ドイツ連邦共和国デー 5 1 3 8 1 レーフェルクーゼン・アムアレンツベルク 8 5 アー

審査官 榎本 佳予子

(56)参考文献 特開昭 6 3 - 0 6 0 9 7 5 (J P , A)

(58)調査した分野(Int.Cl. , D B 名)

C07D249/12

C07D401/06

C07D405/06

A01N 43/653

CAplus(STN)

REGISTRY(STN)